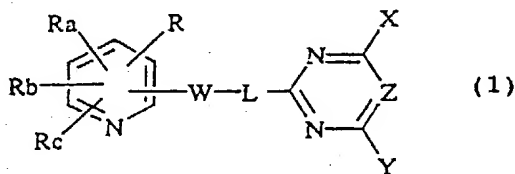




(51) 国際特許分類6 C07D 401/12, 401/14, A01N 43/54, 43/66	A1	(11) 国際公開番号 WO98/57957
		(43) 国際公開日 1998年12月23日(23.12.98)
(21) 国際出願番号 PCT/JP98/02684	縄巻 勤(NAWAMAKI, Tsutomu)[JP/JP]	
(22) 国際出願日 1998年6月18日(18.06.98)	渡辺重臣(WATANABE, Shigeomi)[JP/JP]	
(30) 優先権データ	中平国光(NAKAHIRA, Kunimitsu)[JP/JP]	
特願平9/160808 1997年6月18日(18.06.97) JP	野口順子(NOGUCHI, Junko)[JP/JP]	
特願平9/305407 1997年11月7日(07.11.97) JP	〒349-0218 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470	
特願平10/138324 1998年5月20日(20.05.98) JP	日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama, (JP)	
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)	(74) 代理人	
日産化学工業株式会社	弁理士 津国 肇(TSUKUNI, Hajime)	
(NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)(JP/JP)	〒105-0001 東京都港区虎ノ門1丁目22番12号 SVAX TSビル	
〒101-0054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo, (JP)	Tokyo, (JP)	
(72) 発明者; および	(81) 指定国 AL, AU, BA, BB, BG, BR, CA, CN, CU, CZ, EE,	
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ)	GE, GW, HU, ID, IL, IS, JP, KR, LC, LK, LR, LT, LV, MG, MK,	
森本勝之(MORIMOTO, Katsushi)[JP/JP]	MN, MX, NO, NZ, PL, RO, SG, SI, SK, SL, TR, TT, UA, US, UZ,	
古澤裕之(FURUSAWA, Hiroyuki)[JP/JP]	VN, YU, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW),	
寺地拓己(TERACHI, Takumi)[JP/JP]	ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州	
〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1	特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU,	
日産化学工業株式会社 中央研究所内 Chiba, (JP)	MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,	
		ML, MR, NE, SN, TD, TG).
		添付公開書類
		国際調査報告書

(54)Title: PYRIDINE COMPOUNDS AND HERBICIDES

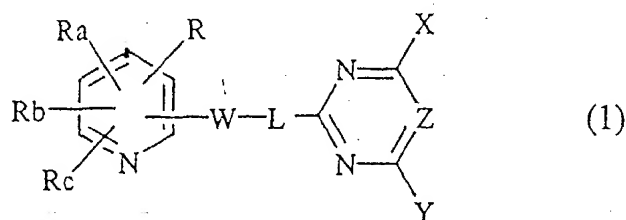
(54)発明の名称 ピリジン化合物および除草剤



(57) Abstract

Pyridine compounds of general formula (1): [wherein R represents COR¹ (in which R¹ is hydrogen, hydroxyl, C₁₋₆ alkoxyl or the like), cyano or hydroxymethyl; R_a, R_b and R_c each independently represents hydrogen, halogen cyano or the like; X and Y each independently represent hydrogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ alkoxyl; Z represents CH or nitrogen; W¹ represents oxygen, sulfur or the like; L represents a C₁₋₃ alkylene chain; and n represents 0, 1, 2 or 3] and pesticides containing them.

式(1):



式中、RはCOR¹、シアノ基またはヒドロキシメチル基などを表し、R¹は水素原子、水酸基またはC₁₋₃アルコキシ基などを表し、Ra、RbおよびRcは各々独立して水素原子、ハロゲン原子またはシアノ基などを表し、XおよびYは各々独立して水素原子、C₁₋₃アルキル基またはC₁₋₃アルコキシ基などを表し、ZはCHまたは窒素原子を表し、Wは酸素原子または硫黄原子などを表し、LはC₁₋₃アルキレン鎖を表し、nは0、1、2または3を表す、

で表されるピリジン化合物およびそれを含有する農薬が提供される。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AL	アルバニア	FI	フィンランド	LK	スリ・ランカ	SI	スロヴェニア
AM	アルメニア	FR	フランス	LR	リベリア	SK	スロヴァキア
AT	オーストリア	GA	ガボン	LS	レソト	SL	シエラ・レオネ
AU	オーストラリア	GB	英国	LT	リトアニア	SN	セネガル
AZ	アゼルバイジャン	GD	グレナダ	LU	ルクセンブルグ	SZ	スワジランド
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	TD	チャード
BB	バルバドス	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴ
BE	ベルギー	GM	ガンビア	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BF	ブルキナ・ファソ	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BG	ブルガリア	GW	ギニア・ビサウ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア	TR	トルコ
BJ	ベナン	GR	ギリシャ		共和国	TT	トリニダード・トバゴ
BR	ブラジル	HR	クロアチア	ML	マリ	UA	ウクライナ
BY	ベラルーシ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	UG	ウガンダ
CA	カナダ	ID	インドネシア	MR	モーリタニア	US	米国
CF	中央アフリカ	IE	アイルランド	MW	マラウイ	UZ	ウズベキスタン
CG	コンゴ	IL	イスラエル	MX	メキシコ	VN	ヴェトナム
CH	スイス	IN	インド	NE	ニジェール	YU	ユーゴスラヴィア
CI	コートジボアール	IS	アイスランド	NL	オランダ	ZW	ジンバブエ
CM	カメルーン	IT	イタリア	NO	ノルウェー		
CN	中国	JP	日本	NZ	ニュージーランド		
CU	キューバ	KE	ケニア	PL	ポーランド		
CY	キプロス	KG	キルギスタン	PT	ポルトガル		
CZ	チェッコ	KP	北朝鮮	RO	ルーマニア		
DE	ドイツ	KR	韓国	RU	ロシア		
DK	デンマーク	KZ	カザフスタン	SD	スーダン		
EE	エストニア	LC	セントルシア	SE	スウェーデン		
ES	スペイン	LI	リヒテンシュタイン	SG	シンガポール		

明 細 書

ピリジン化合物および除草剤

5 技術分野

本発明はピリジン化合物を有効成分とする農薬、特に除草剤および新規なピリジン化合物に関するものである。

背景技術

- 10 特開昭64-84号公報、特開平1-250378号公報、特開平1-290671号公報、特開平3-232881号公報、特開平4-225964号公報、特開平4-230366号公報、特開平4-305577号公報、特開平4-342574号公報、特開平6-41116号公報、特開平6-41118号公報および特開平6-316574号公報にピリミジルオキシピリジン類が、また、
15 特開平4-327578にはピリミジルメチルオキシサリチル酸類がそれぞれ開示されており、それらの化合物が除草活性を有することが知られている。

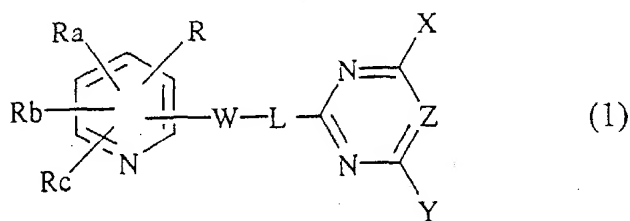
- 特開平6-73022号公報および特表平9-507249号公報に開示されている化合物が除草活性を有することが、また、英国特許公開2285045号公報に開示されている化合物がCNSおよびストレス関連病の治療薬として有効
20 であることが知られている。

本発明は、ピリジン化合物を有効成分とする農薬、特に除草剤を提供する。

発明の開示

本発明は、

- 25 1. 式(1):



式中、

RはCOR¹、シアノ基、ヒドロキシメチル基、アミノメチル基、ニトロメチル基またはハロメチル基を表し、

5 R¹は水素原子、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、ベンジルオキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、シアノアミノ基、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁₋₄ハロアルキルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基（C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）、ハロゲン原子によつて置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルコキシ基によって置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基によって置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキル基、イミダゾール-1-イル基、ピラゾール-1-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 3, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル基、1, 2, 3, 5-テトラゾール-1-イル基、ON=CR²R³、R⁴R⁵N、OCH₂OC(O)R⁶またはOMを表し、

20 R²およびR³は各々独立して水素原子、C₁₋₆アルキル基またはフェニル基（C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）を表し、

R⁴およびR⁵は各々独立して水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキル基で置換されたC₁₋₂アルキル基、C₁₋₄アルコキシ基（但し、R⁴とR⁵が同時にアルコキシ基を表すことはない。）、フェニル基（C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）またはベンジル基を表し、但し、R⁴およびR⁵は結合している窒素原子とともに3~9員環を構成してもよく、環内に酸素原子、硫黄原子、C₁₋₄アルキル基で置換されていてもよい窒素原子、カルボニル基、スルホニル基または不飽

和結合を含んでもよく、環はC₁₋₄アルキル基によって置換されていてもよく、環はC₁₋₄アルキレンによって架橋されていてもよく、環はベンゼン環によって縮合されていてもよく、

R⁶はフェニル基（C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）、フェニル基（C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）によって置換されたC₁₋₃アルキル基またはナフチル基を表し、

10 Mはアルカリ金属原子、アルカリ土類金属原子またはC₁₋₆アルキル基で置換されていてもよいアンモニウムカチオンを表し、

R a、R b および R c は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニ
トロ基、水酸基、メルカプト基、C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆
アルキニル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₄アルキル基、
15 C₁₋₆アルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、C
₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル
基、ホルミル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、
ベンジルオキシカルボニル基、カルボキシ基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキ
シ基、水酸基により置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆
20 ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₄アルコキシC₁₋₄アルキル基、
C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルケニル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルキニル基、フ
ェニル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シア
ノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる
1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェノキシ基 (C₁
25 ₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ
基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されて
いてもよい。)、フェニルチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁
₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1また
は2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェニルカルボニル基 (C

- 1-4アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェニルスルホニル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、ベンジル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、ベンジルオキシ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリーロキシ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチルオキシ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリール基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチルチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、シクロプロピル基 (ハロゲン原子およびC₁₋₄アルキル基から選ばれる1または

2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基(ハロゲン原子およびC₁-アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、 R^4R^5N 、 $R^7ON=R^8C$ 、 $R^4R^5NN=R^8C$ 、 R^4R^5NC (W^1)、(R^9W^1) ($R^{10}W^1$) $R^{11}C$ 、アジド基またはアジドメチル基を表し、

- 5 5~6員ヘテロアリアルはチオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、ピロール-1-イル基、ピロール-2-イル基、ピロール-3-イル基、オキサゾール-2-イル基、オキサゾール-4-イル基、オキサゾール-5-イル基、チアゾール-2-イル基、チアゾール-4-イル基、チアゾール-5-イル基、イミダゾール-1-イル基、イミダゾール-2-イル基、イミダゾール-4-イル基、イミダゾール-5-イル基、
- 10 イソオキサゾール-3-イル基、イソオキサゾール-4-イル基、イソオキサゾール-5-イル基、イソチアゾール-3-イル基、イソチアゾール-4-イル基、イソチアゾール-5-イル基、ピラゾール-1-イル基、ピラゾール-3-イル基、ピラゾール-4-イル基、ピラゾール-5-イル基、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル基、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基、1, 3, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 3, 4-トリアゾール-2-イル基、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル基、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル基、1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル基、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-5-イル基、1, 2, 3-オキサジアゾール-4-イル基、1, 2, 3-オキサジアゾール-5-イル基、1, 2, 3-チアジアゾール-3-イル基、1, 2, 3-チアジアゾール-5-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-4-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-5-イル基、1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル基、1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル基、1, 2, 3, 5-テトラゾール-1-イル基、1, 2, 3, 5-テトラゾール-4-イル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、ピリミジン-2-イル基、ピリミジン-5-イル基、ピリミジン-4-イル基、ピラジン-2-イル基、ピリダジン-3-イル基、ピリダジン-4-イル基、1, 3, 5-ト
- 25

リアジン-2-イル基、1, 2, 4-トリアジン-3-イル基、1, 2, 4-トリアジン-5-イル基または1, 2, 4-トリアジン-6-イル基を表し、

R^7 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{3-6} シクロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基または C_{1-4} ハロアルキル基を表し、

5 R^8 は水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、

R^9 および R^{10} は各々独立して C_{1-6} アルキル基を表し、但し、 R^9 および R^{10} は結合している酸素原子または硫黄原子とともに5または6員環を構成してもよく、

R^{11} は水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、

10 X および Y は各々独立して水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、

C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} ハロアルコキシ基またはハロゲン原子を表し、

Z はCHまたは窒素原子を表し、

W は酸素原子、硫黄原子または $R^{12}N$ を表し、

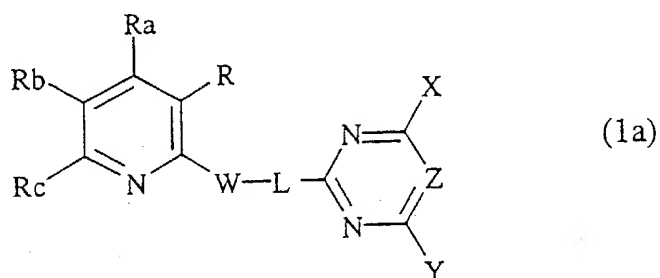
R^{12} は水素原子、ホルミル基または C_{1-4} アルキル基を表し、

15 W^1 は酸素原子または硫黄原子を表し、

L は C_{1-3} アルキレン鎖を表し、

n は0、1、2または3を表す。

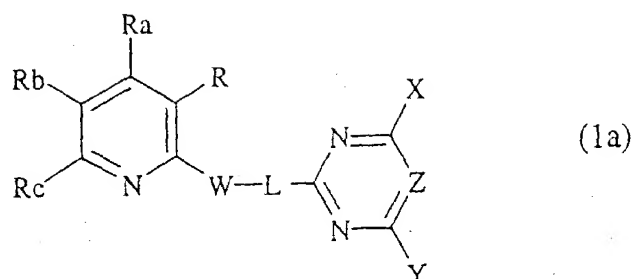
但し、式(1a)：



を表す場合、 Rb および Rc は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、
 20 ニトロ基、水酸基、メルカプト基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{3-6} シクロアルキル基、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-4} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、ホルミル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル

- 基、ベンジルオキシカルボニル基、カルボキシル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル
 オキシ基、水酸基により置換された C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、
 C_{2-6} ハロアルケニル基、 C_{2-6} ハロアルキニル基、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-4} アル
 キル基、 C_{1-4} アルコキシ C_{2-4} アルケニル基、 C_{1-4} アルコキシ C_{2-4} アルキニ
 5 ル基、フェニル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ
 基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から
 選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5～6員ヘ
 テロアリール基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、
 シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ば
 10 れる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5～6員ヘテロ
 アリールメチル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ
 基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から
 選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5～6員ヘ
 テロアリールチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキ
 15 シ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子か
 ら選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5～6員
 ヘテロアリールメチルチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4}
 アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲ
 ン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、
 20 シクロプロピル基 (ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または
 2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基 (ハロゲン原子お
 よび C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されて
 いてもよい)、 R^4R^5N 、 $R^7ON=R^8C$ 、 $R^4R^5NN=R^8C$ 、 R^4R^5NC
 (W^1)、(R^9W^1) ($R^{10}W^1$) $R^{11}C$ 、アジド基またはアジドメチル基を表す、
 25 で表されるピリジン化合物を有効成分として含有する除草剤。

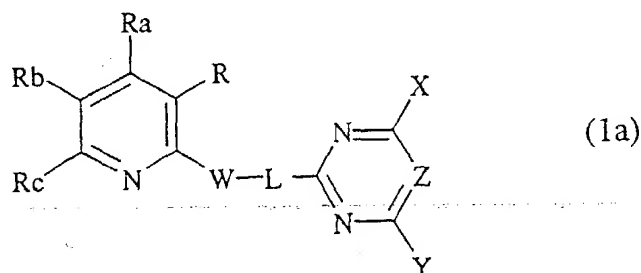
2. 式 (1 a):



- 式中、R a、R bおよびR cは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、メルカプト基、C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₄アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、
- 5 C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、ホルミル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、水酸基により置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₄アルコキシC₁₋₄アルキル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄
- 10 アルケニル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルキニル基、フェニル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてよい。)、5~6員ヘテロアリール基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてよい。)、5~6員ヘテロアリールメチル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてよい。)、5~6員ヘテロアリールチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてよい。)、5~6員ヘテロアリールメチルチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または
- 20

- 2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、シクロプロピル基 (ハロゲン原子およびC₁₋₄アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基 (ハロゲン原子およびC₁₋₄アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、R⁴R⁵N、R⁴ON=R⁸C、R⁴R⁵NN=R⁸C、R⁴R⁵NC (W¹)、(R⁹W¹) (R¹⁰W¹) R¹¹C、アジド基またはアジドメチル基を表す、
- 5 5 として表される上記1のピリジン化合物。

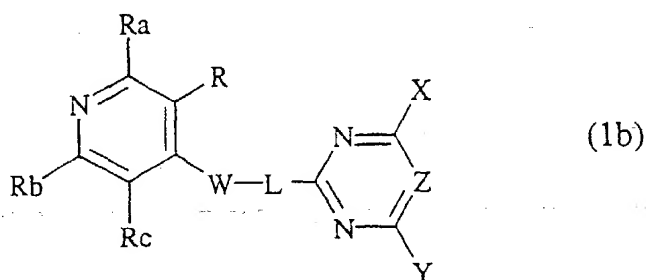
3. 式 (1a):



- 式中、R_aはフェノキシ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェニルチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェニルカルボニル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、
- 10 フェニルスルホニル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、ベンジル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、
- 15 ベンジルオキシ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールオキシ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、
- 20 5~6員ヘテロアリール基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリール基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、

ル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されている。また、または5~6員ヘテロアリールメチルオキシ基(C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されている。)を表す、で表される上記1のピリジン化合物。

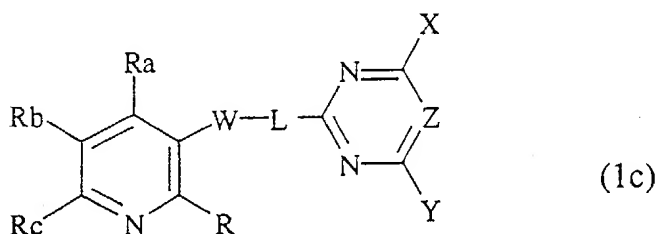
4. 式 (1 b):



員ヘテロアリール基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチルチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチルオキシ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、シクロプロピル基 (ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基 (ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、 R^4R^5N 、 $R^7ON=R^8C$ 、 $R^4R^5NN=R^8C$ 、 $R^4R^5NC(W^1)$ 、 $(R^9W^1)(R^{10}W^1)R^{11}C$ 、アジド基またはアジドメチル基を表す、

で表される上記1のピリジン化合物。

5. 式 (1c) :



式中、 R_a 、 R_b および R_c は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、メルカプト基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_2

- ₆アルキニル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₄アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、ホルミル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルボキシル基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、水酸基により置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₄アルコキシC₁₋₄アルキル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルケニル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルキニル基、フェニル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールオキシ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリール基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールメチル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールメチルチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールメチルオキシ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)。

れていてもよい)、シクロプロピル基 (ハロゲン原子およびC₁₋₄アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基 (ハロゲン原子およびC₁₋₄アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、R⁴R⁵N、R⁷ON=R⁸C、R⁴R⁵NN=R⁸C、R⁴R⁵NC (W¹)、(R⁹W¹) (R¹⁰W¹) R¹¹C、アジド基またはアジドメチル基を表す、

で表される上記1のピリジン化合物。

6. 上記2ないし上記5のピリジン化合物を有効成分として含有する農薬。

7. 上記2ないし上記5のピリジン化合物を有効成分として含有する除草剤。

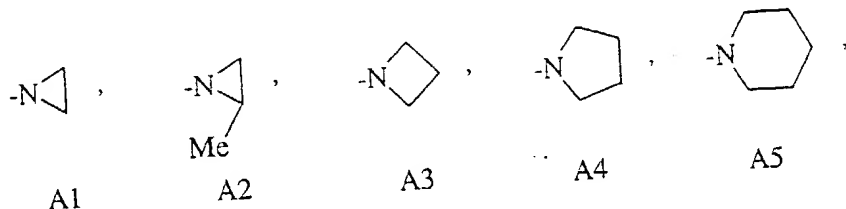
10 である。

発明を実施するための最良の形態

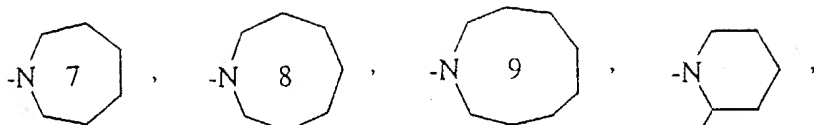
本発明化合物および本発明化合物の中間体の置換基R、Ra、Rb、Rc、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、X、YおよびLを具体的に列記する。但し、記号はそれぞれ以下の意味を示す。

Me: メチル基、Et: エチル基、Pr-n: ノルマルプロピル基、Pr-i: イソプロピル基、Bu-n: ノルマルブチル基、Bu-i: イソブチル基、Bu-sec: セカンダリーブチル基、Bu-ter: ターシャリーブチル基、Pen-n: ノルマルペンチル基、Hex-n: ノルマルヘキシル基、Pr-cyc: シクロプロピル基、Bu-cyc: シクロブチル基、Pen-cyc: シクロペンチル基、Hex-cyc: シクロヘキシル基、Ph: フェニル基、Naph: ナフチル基

A1~A37、B1~B8およびQ1~Q144は以下の意味を表す。



14

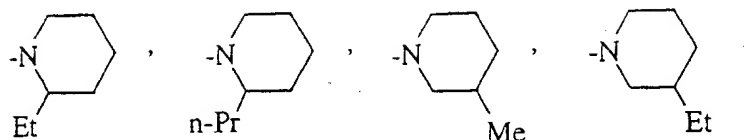


A6

A7

A8

A9

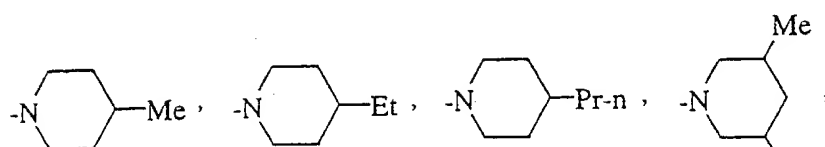


A10

A11

A12

A13

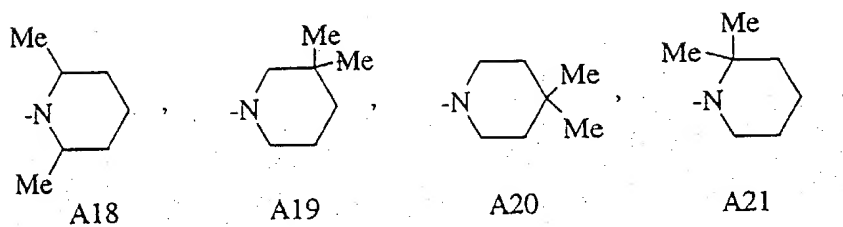


A14

A15

A16

A17

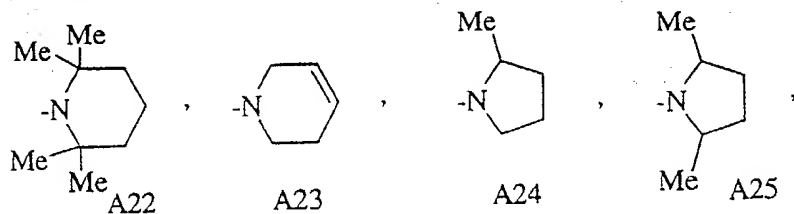


A18

A19

A20

A21

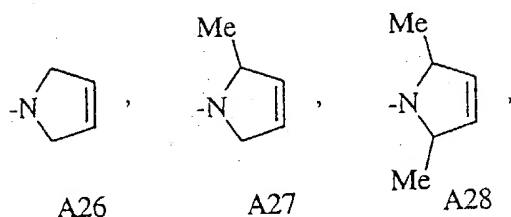


A22

A23

A24

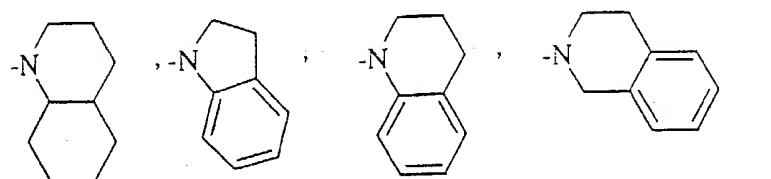
A25



A26

A27

A28



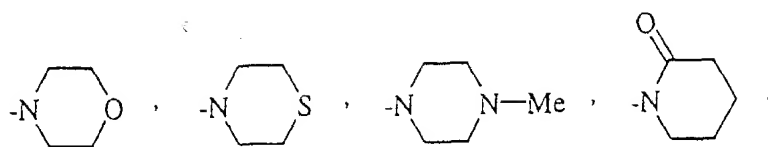
A29

A30

A31

A32

15

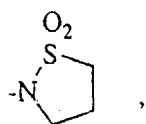


A33

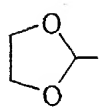
A34

A35

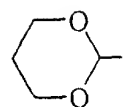
A36



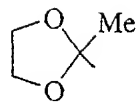
A37



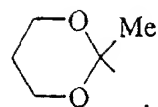
B1



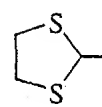
B2



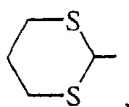
B3



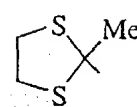
B4



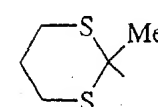
B5



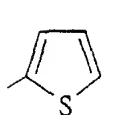
B6



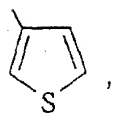
B7



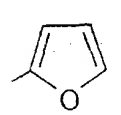
B8



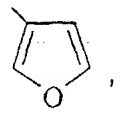
Q1



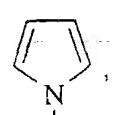
Q2



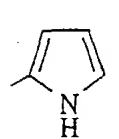
Q3



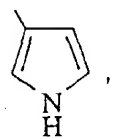
Q4



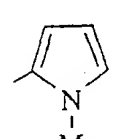
Q5



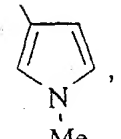
Q6



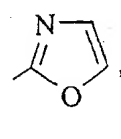
Q7



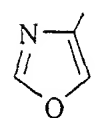
Q8



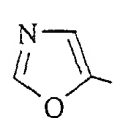
Q9



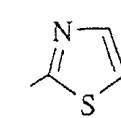
Q10



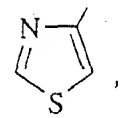
Q11



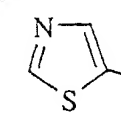
Q12



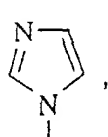
Q13



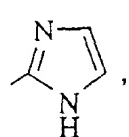
Q14



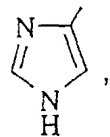
Q15



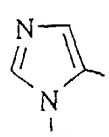
Q16



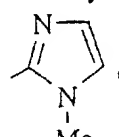
Q17



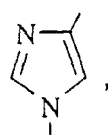
Q18



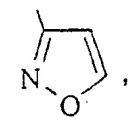
Q19



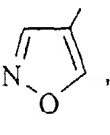
Q20



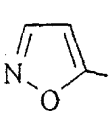
Q21



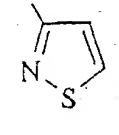
Q22



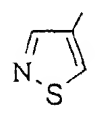
Q23



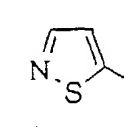
Q24



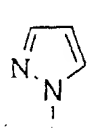
Q25



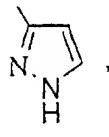
Q26



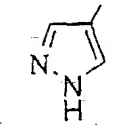
Q27



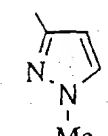
Q28



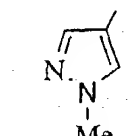
Q29



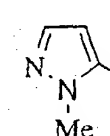
Q30



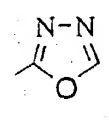
Q31



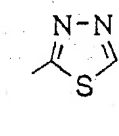
Q32



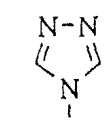
Q33



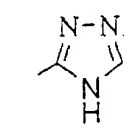
Q34



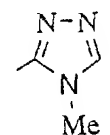
Q35



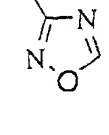
Q36



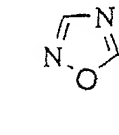
Q37



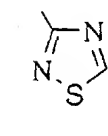
Q38



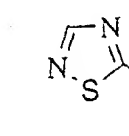
Q39



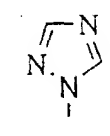
Q40



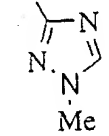
Q41



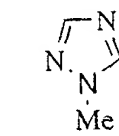
Q42



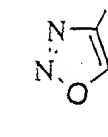
Q43



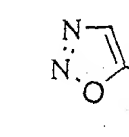
Q44



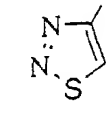
Q45



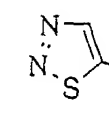
Q46



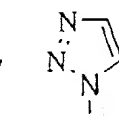
Q47



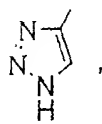
Q48



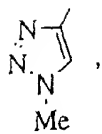
Q49



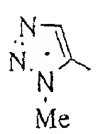
Q50



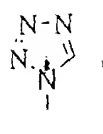
Q51



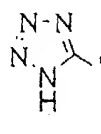
Q52



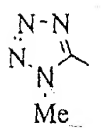
Q53



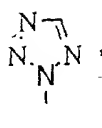
Q54



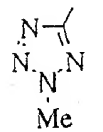
Q55



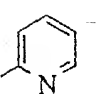
Q56



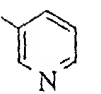
Q57



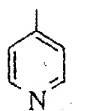
Q58



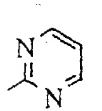
Q59



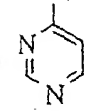
Q60



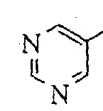
Q61



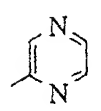
Q62



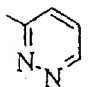
Q63



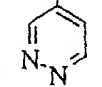
Q64



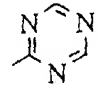
Q65



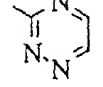
Q66



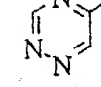
Q67



Q68



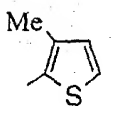
Q69



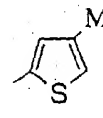
Q70



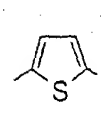
Q71



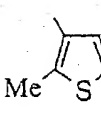
Q72



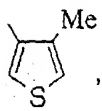
Q73



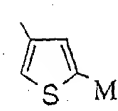
Q74



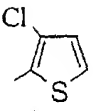
Q75



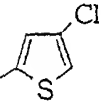
Q76



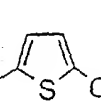
Q77



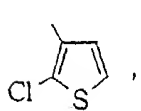
Q78



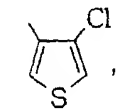
Q79



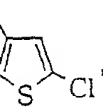
Q80



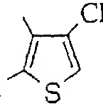
Q81



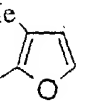
Q82



Q83

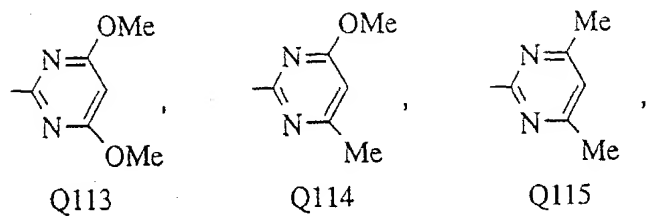
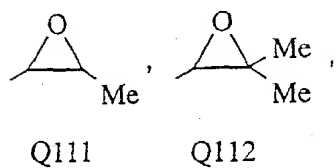
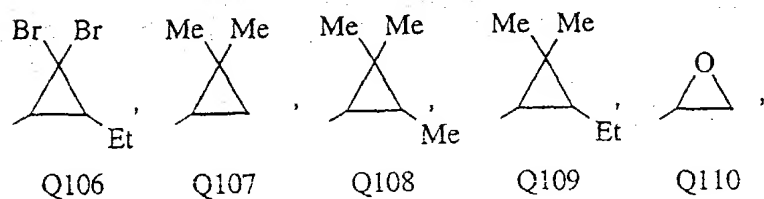
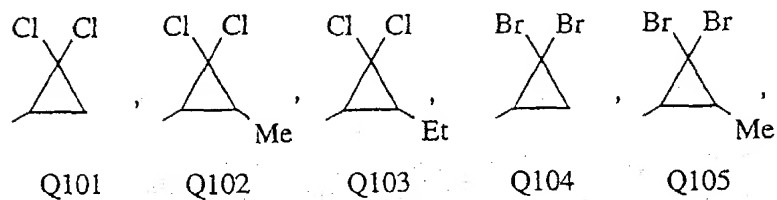
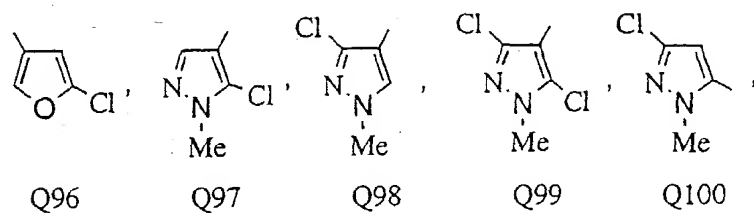
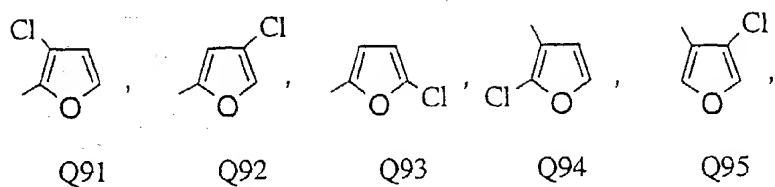
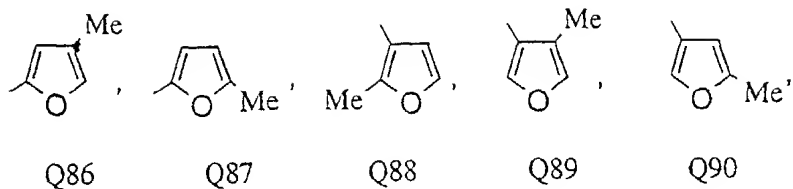


Q84

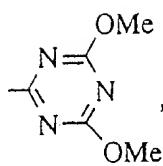


Q85

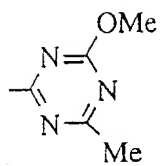
18



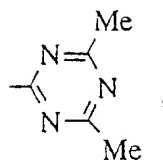
19



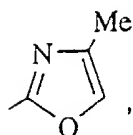
Q116



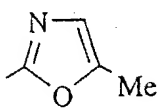
Q117



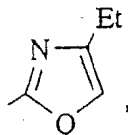
Q118



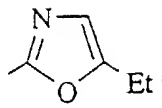
Q119



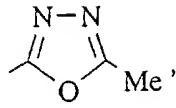
Q120



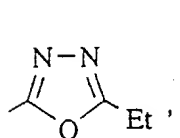
Q121



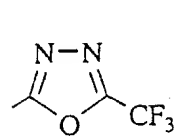
Q122



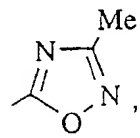
Q123



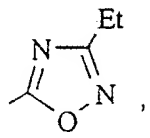
Q124



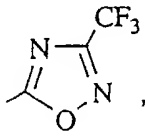
Q125



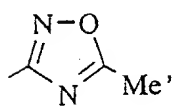
Q126



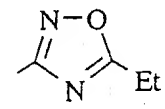
Q127



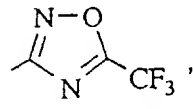
Q128



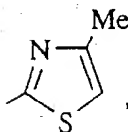
Q129



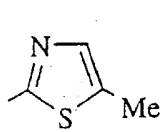
Q130



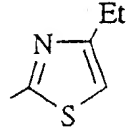
Q131



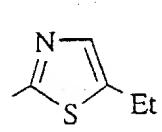
Q132



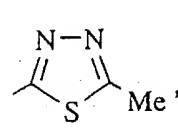
Q133



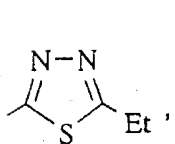
Q134



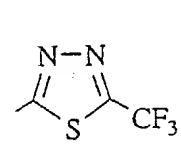
Q135



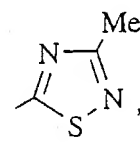
Q136



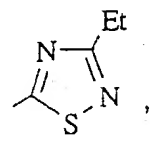
Q137



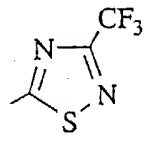
Q138



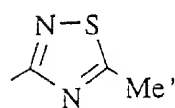
Q139



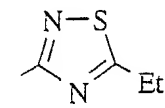
Q140



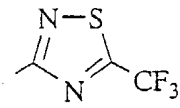
Q141



Q142



Q143



Q144

(本発明化合物の置換基 R の具体例)

COR¹, CN, CH₂OH, CH₂NH₂, CH₂NO₂, CH₂F, CHF₂, CF₃, CH₂Cl, CHCl₂, CCl₃,
CH₂Br, CHBr₂, CBr₃, CH₂I, CHI₂

(本発明化合物の置換基 R a、R b および R c の具体例)

- 5 H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, OH, SH, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso,
Bu-sec, Bu-ter, Pen-n, Et₂CH, Hex-n, Me(Pr-n)CH, Me(Bu-n)CH, Et(Pr-n)CH,
Me₂CHCH₂CH₂, CH=CH₂, CH=CHMe, CH=CHEt, CH=CMe₂, CH=CEt₂, CMe=CH₂,
CMe=CHMe, CMe=CMe₂, CH₂CH=CH₂, CH₂CH=CHMe, CH₂CH=CHEt, CH₂CMe=CH₂, CH₂
CH₂CH=CH₂, CH₂CH₂CH=CHMe, CH₂CH=CMe₂, CHMeCH=CH₂, CH₂CMe=CHMe,
10 CHMeCH=CHMe, CH₂CMe=CHEt, CH₂CH₂CH=CMe₂, CH₂CMe=CMe₂, CH=C=CH₂, C≡CH,
C≡CMe, C≡CEt, CH₂C≡CH, CH₂C≡CMe, CH₂C≡CEt, CH₂CH₂C≡CH, CH₂CH₂C≡
CMe, CHMeC≡CH, CHMeC≡CMe, Pr-cyc, Bu-cyc, Pen-cyc, Hex-cyc, CH₂(Pr-
cyc), CH₂(Bu-cyc), CH₂(Pen-cyc), CH₂(Hex-cyc), OMe, OEt, OPr-n, OPr-iso,
OBu-n, OBU-iso, OBU-sec, OBU-ter, OPen-n, Et₂CHO, OHex-n, Me(Pr-n)CHO,
15 Me(Bu-n)CHO, Et(Pr-n)CHO, Me₂CHCH₂CH₂O, OCH₂CH=CH₂, OCH=CH₂, OCH=CHMe,
OCH₂CH=CHMe, OCH₂CH=CHEt, OCH₂CMe=CH₂, OCH₂CH₂CH=CH₂, OCH₂CH₂CH=CHMe,
OCH₂CH=CMe₂, OCHMeCH=CH₂, OCH₂CMe=CHMe, OCHMeCH=CHMe, OCH₂CMe=CHEt, OCH
2CH₂CH=CMe₂, OCH₂CMe=CMe₂, OC≡CH, OC≡CMe, OCH₂C≡CH, OCH₂C≡CMe, OCH₂
C≡CEt, OCH₂CH₂C≡CH, OCH₂CH₂C≡CMe, OCHMeC≡CH, OCHMeC≡CMe, SMe, SEt,
20 SPr-n, SPr-iso, SBu-n, SBu-iso, SBu-sec, SBu-ter, SPen-n, Et₂CHS, SHex-
n, SMe, SOEt, SOPr-n, SOPr-iso, SOBu-n, SOBu-iso, SOBu-sec, SOBu-ter,
SOPen-n, Et₂CHSO, SOHex-n, S(O)₂Me, S(O)₂Et, S(O)₂Pr-n, S(O)₂Pr-iso,
S(O)₂Bu-n, S(O)₂Bu-iso, S(O)₂Bu-sec, S(O)₂Bu-ter, S(O)₂Pen-n, Et₂CHS(O)
2, S(O)₂Hex-n, CHO, MeCO, EtCO, (Pr-n)CO, (Pr-iso)CO, (Bu-n)CO, (Bu-
25 iso)CO, (Bu-sec)CO, (Bu-ter)CO, (Pen-n)CO, CO₂Me, CO₂Et, CO₂Pr-n, CO₂
Pr-iso, CO₂Bu-n, CO₂Bu-iso, CO₂Bu-sec, CO₂Bu-ter, CO₂Pen-n, CO₂CH₂Ph,
CO₂H, MeCOO, EtCOO, (Pr-n)COO, (Pr-iso)COO, (Bu-n)COO, (Bu-iso)COO,
(Bu-sec)COO, (Bu-ter)COO, (Pen-n)COO, HOCH₂, HOCH₂CH₂, HOCH₂CH₂CH₂,
MeCH(OH), MeCH(OH)CH₂, MeCH(OH)CH₂CH₂, EtCH(OH)CH₂, CH₂F, CH₂Cl, CH₂Br,

- CH₂I, CHF₂, CHCl₂, CHBr₂, CF₃, CCl₃, CBr₃, CClF₂, CBrF₂, CH₂FCH₂, CHF₂
 CH₂, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CF₃CF₂CF₂, ClCH₂CH₂, BrCH₂CH₂, MeCHBr, CCl₃CH₂, CF
 3CH₂CH₂, CCl₃CH₂CH₂, ClCH₂CH₂CH₂, FCH₂CH₂CH₂, CF₃CF₂CH₂, ClCH₂CH₂CH₂CH₂,
 CH=CHCl, CH=CCl₂, CH=CHBr, CH=CBr₂, Ph, 2-Cl-Ph, 3-Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2,4-
 5 Cl₂-Ph, 3,5-Cl₂-Ph, 2,6-Cl₂-Ph, 2,3-Cl₂-Ph, 2,5-Cl₂-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph,
 4-F-Ph, 2-F-4-Cl-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 4-Br-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-
 Ph, 2,4-Me₂-Ph, 3,5-Me₂-Ph, 2,6-Me₂-Ph, 2,3-Me₂-Ph, 2,5-Me₂-Ph, 2-MeO-
 Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF₃-Ph, 3-CF₃-Ph, 4-CF₃-Ph, 2,4,6-Cl₃-Ph,
 2,3,5-Cl₃-Ph, 2,3,4-Cl₃-Ph, 2-NO₂-Ph, 3-NO₂-Ph, 4-NO₂-Ph, 2,4-(NO₂)₂-Ph,
 10 2-CN-Ph, 3-CN-Ph, 4-CN-Ph, 2-MeSO₂-Ph, 3-MeSO₂-Ph, 4-MeSO₂-Ph, MeOCH₂,
 EtOCH₂, (Pr-n)OCH₂, (Pr-iso)OCH₂, MeOCH₂CH₂, EtOCH₂CH₂, Me(MeO)CH,
 Me(EtO)CH, CH=CHOMe, CH=C(OMe)₂, CH=CHOEt, CH=C(OEt)₂, Q1, Q2, Q3, Q4,
 Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q14, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19,
 Q20, Q21, Q22, Q23, Q24, Q25, Q26, Q27, Q28, Q29, Q30, Q31, Q32, Q33,
 15 Q34, Q35, Q36, Q37, Q38, Q39, Q40, Q41, Q42, Q43, Q44, Q45, Q46, Q47,
 Q48, Q49, Q50, Q51, Q52, Q53, Q54, Q55, Q56, Q57, Q58, Q59, Q60, Q61,
 Q62, Q63, Q64, Q65, Q66, Q67, Q68, Q69, Q70, Q71, Q72, Q73, Q74, Q75,
 Q76, Q77, Q78, Q79, Q80, Q81, Q82, Q83, Q84, Q85, Q86, Q87, Q88, Q89,
 Q90, Q91, Q92, Q93, Q94, Q95, Q96, Q97, Q98, Q99, Q100, Q101, Q102, Q103,
 20 Q104, Q105, Q106, Q107, Q108, Q109, Q110, Q111, Q112, Q113, Q114, Q115,
 Q116, Q117, Q118, Q119, Q120, Q121, Q122, Q123, Q124, Q125, Q126, Q127,
 Q128, Q129, Q130, Q131, Q132, Q133, Q134, Q135, Q136, Q137, Q138, Q139,
 Q140, Q141, Q142, Q143, Q144, PhO, 2-Cl-PhO, 3-Cl-PhO, 4-Cl-PhO, 2,4-Cl
 2-PhO, 3,5-Cl₂-PhO, 2,6-Cl₂-PhO, 2,3-Cl₂-PhO, 2,5-Cl₂-PhO, 2-F-PhO, 3-
 25 F-PhO, 4-F-PhO, 2-F-4-Cl-PhO, 2-Br-PhO, 3-Br-PhO, 4-Br-PhO, 2-Me-PhO, 3-
 Me-PhO, 4-Me-PhO, 2,4-Me₂-PhO, 3,5-Me₂-PhO, 2,6-Me₂-PhO, 2,3-Me₂-PhO,
 2,5-Me₂-PhO, 2-MeO-PhO, 3-MeO-PhO, 4-MeO-PhO, 2-CF₃-PhO, 3-CF₃-PhO, 4-
 CF₃-PhO, 2,4,6-Cl₃-PhO, 2,3,5-Cl₃-PhO, 2,3,4-Cl₃-PhO, 2-NO₂-PhO, 3-NO₂-
 PhO, 4-NO₂-PhO, 2-CN-PhO, 3-CN-PhO, 4-CN-PhO, PhS, 2-Cl-PhS, 3-Cl-PhS,

4-Cl-PhS, 2,4-Cl₂-PhS, 3,5-Cl₂-PhS, 2,6-Cl₂-PhS, 2,3-Cl₂-PhS, 2,5-Cl₂-PhS, 2-F-PhS, 3-F-PhS, 4-F-PhS, 2-F-4-Cl-PhS, 2-Br-PhS, 3-Br-PhS, 4-Br-PhS, 2-Me-PhS, 3-Me-PhS, 4-Me-PhS, 2,4-Me₂-PhS, 3,5-Me₂-PhS, 2,6-Me₂-PhS, 2,3-Me₂-PhS, 2,5-Me₂-PhS, 2-MeO-PhS, 3-MeO-PhS, 4-MeO-PhS, 2-CF₃-PhS, 3-CF₃-PhS, 4-CF₃-PhS, 2,4,6-Cl₃-PhS, 2,3,5-Cl₃-PhS, 2,3,4-Cl₃-PhS, 2-NO₂-PhS, 3-NO₂-PhS, 4-NO₂-PhS, 2-CN-PhS, 3-CN-PhS, 4-CN-PhS, PhCO, 2-Cl-PhCO, 3-Cl-PhCO, 4-Cl-PhCO, 2,4-Cl₂-PhCO, 3,5-Cl₂-PhCO, 2,6-Cl₂-PhCO, 2,3-Cl₂-PhCO, 2,5-Cl₂-PhCO, 2-F-PhCO, 3-F-PhCO, 4-F-PhCO, 2-F-4-Cl-PhCO, 2-Br-PhCO, 3-Br-PhCO, 4-Br-PhCO, 2-Me-PhCO, 3-Me-PhCO, 4-Me-PhCO, 2,4-Me₂-PhCO, 3,5-Me₂-PhCO, 2,6-Me₂-PhCO, 2,3-Me₂-PhCO, 2,5-Me₂-PhCO, 2-MeO-PhCO, 3-MeO-PhCO, 4-MeO-PhCO, 2-CF₃-PhCO, 3-CF₃-PhCO, 4-CF₃-PhCO, 2,4,6-Cl₃-PhCO, 2,3,5-Cl₃-PhCO, 2,3,4-Cl₃-PhCO, 2-NO₂-PhCO, 3-NO₂-PhCO, 4-NO₂-PhCO, 2-CN-PhCO, 3-CN-PhCO, 4-CN-PhCO, PhSO₂, 2-Cl-PhSO₂, 3-Cl-PhSO₂, 4-Cl-PhSO₂, 2,4-Cl₂-PhSO₂, 3,5-Cl₂-PhSO₂, 2,6-Cl₂-PhSO₂, 2,3-Cl₂-PhSO₂, 2,5-Cl₂-PhSO₂, 2-F-PhSO₂, 3-F-PhSO₂, 4-F-PhSO₂, 2-F-4-Cl-PhSO₂, 2-Br-PhSO₂, 3-Br-PhSO₂, 4-Br-PhSO₂, 2-Me-PhSO₂, 3-Me-PhSO₂, 4-Me-PhSO₂, 2,4-Me₂-PhSO₂, 3,5-Me₂-PhSO₂, 2,6-Me₂-PhSO₂, 2,3-Me₂-PhSO₂, 2,5-Me₂-PhSO₂, 2-MeO-PhSO₂, 3-MeO-PhSO₂, 4-MeO-PhSO₂, 2-CF₃-PhSO₂, 3-CF₃-PhSO₂, 4-CF₃-PhSO₂, 2,4,6-Cl₃-PhSO₂, 2,3,5-Cl₃-PhSO₂, 2,3,4-Cl₃-PhSO₂, 2-NO₂-PhSO₂, 3-NO₂-PhSO₂, 4-NO₂-PhSO₂, 2-CN-PhSO₂, 3-CN-PhSO₂, 4-CN-PhSO₂, PhCH₂, 2-Cl-PhCH₂, 3-Cl-PhCH₂, 4-Cl-PhCH₂, 2,4-Cl₂-PhCH₂, 3,5-Cl₂-PhCH₂, 2,6-Cl₂-PhCH₂, 2,3-Cl₂-PhCH₂, 2,5-Cl₂-PhCH₂, 2-F-PhCH₂, 3-F-PhCH₂, 4-F-PhCH₂, 2-F-4-Cl-PhCH₂, 2-Br-PhCH₂, 3-Br-PhCH₂, 4-Br-PhCH₂, 2-Me-PhCH₂, 3-Me-PhCH₂, 4-Me-PhCH₂, 2,4-Me₂-PhCH₂, 3,5-Me₂-PhCH₂, 2,6-Me₂-PhCH₂, 2,3-Me₂-PhCH₂, 2,5-Me₂-PhCH₂, 2-MeO-PhCH₂, 3-MeO-PhCH₂, 4-MeO-PhCH₂, 2-CF₃-PhCH₂, 3-CF₃-PhCH₂, 4-CF₃-PhCH₂, 2,4,6-Cl₃-PhCH₂, 2,3,5-Cl₃-PhCH₂, 2,3,4-Cl₃-PhCH₂, 2-NO₂-PhCH₂, 3-NO₂-PhCH₂, 4-NO₂-PhCH₂, 2-CN-PhCH₂, 3-CN-PhCH₂, 4-CN-PhCH₂, PhCH₂O, 2-Cl-PhCH₂O, 3-Cl-PhCH₂O, 4-Cl-PhCH₂O, 2,4-Cl₂-PhCH₂O, 3,5-Cl₂-PhCH₂O, 2,6-Cl₂-PhCH₂O, 2,3-Cl₂-PhCH₂O, 2,5-Cl₂-PhCH₂O, 2-F-PhCH₂O, 3-F-PhCH₂O, 4-F-PhCH₂O, 2-F-4-Cl-PhCH₂O, 2-Br-PhCH₂O, 3-Br-PhCH₂O, 4-Br-PhCH₂O, 2-Me-PhCH₂O, 3-Me-PhCH₂O, 4-Me-PhCH₂O, 2,4-Me₂-PhCH₂O, 3,5-Me₂-PhCH₂O, 2,6-Me₂-PhCH₂O, 2,3-Me₂-PhCH₂O, 2,5-Me₂-PhCH₂O, 2-MeO-PhCH₂O, 3-MeO-PhCH₂O, 4-MeO-PhCH₂O, 2-CF₃-PhCH₂O, 3-CF₃-PhCH₂O, 4-CF₃-PhCH₂O, 2,4,6-Cl₃-PhCH₂O, 2,3,5-Cl₃-PhCH₂O, 2,3,4-Cl₃-PhCH₂O, 2-NO₂-PhCH₂O, 3-NO₂-PhCH₂O, 4-NO₂-PhCH₂O, 2-CN-PhCH₂O, 3-CN-PhCH₂O, 4-CN-PhCH₂O.

-PhCH₂O, 2-F-PhCH₂O, 3-F-PhCH₂O, 4-F-PhCH₂O, 2-F-4-Cl-PhCH₂O, 2-Br-PhCH₂O, 3-Br-PhCH₂O, 4-Br-PhCH₂O, 2-Me-PhCH₂O, 3-Me-PhCH₂O, 4-Me-PhCH₂O, 2,4-Me₂-PhCH₂O, 3,5-Me₂-PhCH₂O, 2,6-Me₂-PhCH₂O, 2,3-Me₂-PhCH₂O, 2,5-Me₂-PhCH₂O, 2-MeO-PhCH₂O, 3-MeO-PhCH₂O, 4-MeO-PhCH₂O, 2-CF₃-PhCH₂O, 3-CF₃-PhCH₂O, 4-CF₃-PhCH₂O, 2,4,6-Cl₃-PhCH₂O, 2,3,5-Cl₃-PhCH₂O, 2,3,4-Cl₃-PhCH₂O, 2-NO₂-PhCH₂O, 3-NO₂-PhCH₂O, 4-NO₂-PhCH₂O, 2-CN-PhCH₂O, 3-CN-PhCH₂O, 4-CN-PhCH₂O, Q59-O, Q60-O, Q61-O, Q62-O, Q63-O, Q64-O, Q65-O, Q66-O, Q67-O, Q68-O, Q69-O, Q70-O, Q71-O, Q113-O, Q114-O, Q115-O, Q116-O, Q117-O, Q118-O, Q1-CH₂O, Q2-CH₂O, Q3-CH₂O, Q4-CH₂O, Q5-CH₂O, Q6-CH₂O, Q7-CH₂O, Q8-CH₂O, Q9-CH₂O, Q10-CH₂O, Q11-CH₂O, Q12-CH₂O, Q13-CH₂O, Q14-CH₂O, Q15-CH₂O, Q16-CH₂O, Q17-CH₂O, Q18-CH₂O, Q19-CH₂O, Q20-CH₂O, Q21-CH₂O, Q22-CH₂O, Q23-CH₂O, Q24-CH₂O, Q25-CH₂O, Q26-CH₂O, Q27-CH₂O, Q28-CH₂O, Q29-CH₂O, Q30-CH₂O, Q31-CH₂O, Q32-CH₂O, Q33-CH₂O, Q34-CH₂O, Q35-CH₂O, Q36-CH₂O, Q37-CH₂O, Q38-CH₂O, Q39-CH₂O, Q40-CH₂O, Q41-CH₂O, Q42-CH₂O, Q43-CH₂O, Q44-CH₂O, Q45-CH₂O, Q46-CH₂O, Q47-CH₂O, Q48-CH₂O, Q49-CH₂O, Q50-CH₂O, Q51-CH₂O, Q52-CH₂O, Q53-CH₂O, Q54-CH₂O, Q55-CH₂O, Q56-CH₂O, Q57-CH₂O, Q58-CH₂O, Q59-CH₂O, Q60-CH₂O, Q61-CH₂O, Q62-CH₂O, Q63-CH₂O, Q64-CH₂O, Q65-CH₂O, Q66-CH₂O, Q67-CH₂O, Q68-CH₂O, Q69-CH₂O, Q70-CH₂O, Q71-CH₂O, Q72-CH₂O, Q73-CH₂O, Q74-CH₂O, Q75-CH₂O, Q76-CH₂O, Q77-CH₂O, Q78-CH₂O, Q79-CH₂O, Q80-CH₂O, Q81-CH₂O, Q82-CH₂O, Q83-CH₂O, Q84-CH₂O, Q85-CH₂O, Q86-CH₂O, Q87-CH₂O, Q88-CH₂O, Q89-CH₂O, Q90-CH₂O, Q91-CH₂O, Q92-CH₂O, Q93-CH₂O, Q94-CH₂O, Q95-CH₂O, Q96-CH₂O, Q97-CH₂O, Q98-CH₂O, Q99-CH₂O, Q100-CH₂O, Q113-CH₂O, Q114-CH₂O, Q115-CH₂O, Q116-CH₂O, Q117-CH₂O, Q118-CH₂O, Q119-CH₂O, Q120-CH₂O, Q121-CH₂O, Q122-CH₂O, Q123-CH₂O, Q124-CH₂O, Q125-CH₂O, Q126-CH₂O, Q127-CH₂O, Q128-CH₂O, Q129-CH₂O, Q130-CH₂O, Q131-CH₂O, Q132-CH₂O, Q133-CH₂O, Q134-CH₂O, Q135-CH₂O, Q136-CH₂O, Q137-CH₂O, Q138-CH₂O, Q139-CH₂O, Q140-CH₂O, Q141-CH₂O, Q142-CH₂O, Q143-CH₂O, Q144-CH₂O, Q1-CH₂, Q2-CH₂, Q3-CH₂, Q4-CH₂, Q5-CH₂, Q6-CH₂, Q7-CH₂, Q8-CH₂, Q9-CH₂, Q10-CH₂, Q11-CH₂, Q12-CH₂, Q13-CH₂, Q14-CH₂,

Q15-CH₂, Q16-CH₂, Q17-CH₂, Q18-CH₂, Q19-CH₂, Q20-CH₂, Q21-CH₂, Q22-CH₂,
Q23-CH₂, Q24-CH₂, Q25-CH₂, Q26-CH₂, Q27-CH₂, Q28-CH₂, Q29-CH₂, Q30-CH₂,
Q31-CH₂, Q32-CH₂, Q33-CH₂, Q34-CH₂, Q35-CH₂, Q36-CH₂, Q37-CH₂, Q38-CH₂,
Q39-CH₂, Q40-CH₂, Q41-CH₂, Q42-CH₂, Q43-CH₂, Q44-CH₂, Q45-CH₂, Q46-CH₂,
Q47-CH₂, Q48-CH₂, Q49-CH₂, Q50-CH₂, Q51-CH₂, Q52-CH₂, Q53-CH₂, Q54-CH₂,
Q55-CH₂, Q56-CH₂, Q57-CH₂, Q58-CH₂, Q59-CH₂, Q60-CH₂, Q61-CH₂, Q62-CH₂,
Q63-CH₂, Q64-CH₂, Q65-CH₂, Q66-CH₂, Q67-CH₂, Q68-CH₂, Q69-CH₂, Q70-CH₂,
Q71-CH₂, Q72-CH₂, Q73-CH₂, Q74-CH₂, Q75-CH₂, Q76-CH₂, Q77-CH₂, Q78-CH₂,
Q79-CH₂, Q80-CH₂, Q81-CH₂, Q82-CH₂, Q83-CH₂, Q84-CH₂, Q85-CH₂, Q86-CH₂,
Q87-CH₂, Q88-CH₂, Q89-CH₂, Q90-CH₂, Q91-CH₂, Q92-CH₂, Q93-CH₂, Q94-CH₂,
Q95-CH₂, Q96-CH₂, Q97-CH₂, Q98-CH₂, Q99-CH₂, Q100-CH₂, Q113-CH₂, Q114-
CH₂, Q115-CH₂, Q116-CH₂, Q117-CH₂, Q118-CH₂, Q119-CH₂, Q120-CH₂, Q121-
CH₂, Q122-CH₂, Q123-CH₂, Q124-CH₂, Q125-CH₂, Q126-CH₂, Q127-CH₂, Q128-
CH₂, Q129-CH₂, Q130-CH₂, Q131-CH₂, Q132-CH₂, Q133-CH₂, Q134-CH₂, Q135-
CH₂, Q136-CH₂, Q137-CH₂, Q138-CH₂, Q139-CH₂, Q140-CH₂, Q141-CH₂, Q142-
CH₂, Q143-CH₂, Q144-CH₂, Q59-S, Q60-S, Q61-S, Q62-S, Q63-S, Q64-S, Q65-
S, Q66-S, Q67-S, Q68-S, Q69-S, Q70-S, Q71-S, Q113-S, Q114-S, Q115-S,
Q116-S, Q117-S, Q118-S, Q119-S, Q120-S, Q121-S, Q122-S, Q123-S, Q124-S,
Q125-S, Q126-S, Q127-S, Q128-S, Q129-S, Q130-S, Q131-S, Q132-S, Q133-S,
Q134-S, Q135-S, Q136-S, Q137-S, Q138-S, Q139-S, Q140-S, Q141-S, Q142-S,
Q143-S, Q144-S, Q1-CH₂S, Q2-CH₂S, Q3-CH₂S, Q4-CH₂S, Q5-CH₂S, Q6-CH₂S,
Q7-CH₂S, Q8-CH₂S, Q9-CH₂S, Q10-CH₂S, Q11-CH₂S, Q12-CH₂S, Q13-CH₂S, Q14-
CH₂S, Q15-CH₂S, Q16-CH₂S, Q17-CH₂S, Q18-CH₂S, Q19-CH₂S, Q20-CH₂S, Q21-
CH₂S, Q22-CH₂S, Q23-CH₂S, Q24-CH₂S, Q25-CH₂S, Q26-CH₂S, Q27-CH₂S, Q28-
CH₂S, Q29-CH₂S, Q30-CH₂S, Q31-CH₂S, Q32-CH₂S, Q33-CH₂S, Q34-CH₂S, Q35-
CH₂S, Q36-CH₂S, Q37-CH₂S, Q38-CH₂S, Q39-CH₂S, Q40-CH₂S, Q41-CH₂S, Q42-
CH₂S, Q43-CH₂S, Q44-CH₂S, Q45-CH₂S, Q46-CH₂S, Q47-CH₂S, Q48-CH₂S, Q49-
CH₂S, Q50-CH₂S, Q51-CH₂S, Q52-CH₂S, Q53-CH₂S, Q54-CH₂S, Q55-CH₂S, Q56-
CH₂S, Q57-CH₂S, Q58-CH₂S, Q59-CH₂S, Q60-CH₂S, Q61-CH₂S, Q62-CH₂S, Q63-

CH₂S, Q64-CH₂S, Q65-CH₂S, Q66-CH₂S, Q67-CH₂S, Q68-CH₂S, Q69-CH₂S, Q70-CH₂S, Q71-CH₂S, Q72-CH₂S, Q73-CH₂S, Q74-CH₂S, Q75-CH₂S, Q76-CH₂S, Q77-CH₂S, Q78-CH₂S, Q79-CH₂S, Q80-CH₂S, Q81-CH₂S, Q82-CH₂S, Q83-CH₂S, Q84-CH₂S, Q85-CH₂S, Q86-CH₂S, Q87-CH₂S, Q88-CH₂S, Q89-CH₂S, Q90-CH₂S, Q91-CH₂S, Q92-CH₂S, Q93-CH₂S, Q94-CH₂S, Q95-CH₂S, Q96-CH₂S, Q97-CH₂S, Q98-CH₂S, Q99-CH₂S, Q100-CH₂S, Q113-CH₂S, Q114-CH₂S, Q115-CH₂S, Q116-CH₂S, Q117-CH₂S, Q118-CH₂S, Q119-CH₂S, Q120-CH₂S, Q121-CH₂S, Q122-CH₂S, Q123-CH₂S, Q124-CH₂S, Q125-CH₂S, Q126-CH₂S, Q127-CH₂S, Q128-CH₂S, Q129-CH₂S, Q130-CH₂S, Q131-CH₂S, Q132-CH₂S, Q133-CH₂S, Q134-CH₂S, Q135-CH₂S, Q136-CH₂S, Q137-CH₂S, Q138-CH₂S, Q139-CH₂S, Q140-CH₂S, Q141-CH₂S, Q142-CH₂S, Q143-CH₂S, Q144-CH₂S, C≡CCl, C≡CBr, C≡CI, CH₂C≡CCl, CH₂C≡CBr, CH₂C≡CI, C≡CMe, C≡COEt, CH₂C≡CMe, CH₂C≡COEt, NR⁴R⁵, R⁷ON=R⁸C, R⁴R⁵NN=R⁸C, R⁴R⁵NC(W¹), (R⁹W¹)(R¹⁰W¹)R¹¹C, N₃, CH₂N₃

(本発明化合物の置換基R¹の具体例)

15 H, OH, OMe, OEt, OPr-n, OPr-iso, OBu-n, OBu-iso, OBu-sec, OBu-ter, OPen-n, Et₂CHO, OHex-n, OCH₂CH=CH₂, OCH₂CH=CHMe, OCH₂CH=CHEt, OCH₂CMe=CH₂, OCH₂CH₂CH=CH₂, OCH₂CH₂CH=CHMe, OCH₂CH=CMe₂, OCHMeCH=CH₂, OCH₂CMe=CHMe, OCHMeCH=CHMe, OCH₂CMe=CHEt, OCH₂CH₂CH=CMe₂, OCH₂CMe=CMe₂, OCH₂C≡CH, OCH₂C≡CMe, OCH₂C≡CEt, OCH₂CH₂C≡CH, OCH₂CH₂C≡CMe, OCHMeC≡CH, OCHMeC≡CMe, PhCH₂O, SMe, SEt, SPr-n, SPr-iso, SBu-n, SBu-iso, SBu-sec, SBu-ter, SPen-n, Et₂CHS, SHex-n, NHSO₂Me, NHSO₂Et, NHSO₂Pr-n, NHSO₂Pr-iso, NHSO₂Bu-n, NHSO₂Bu-iso, NHSO₂Bu-sec, NHSO₂Bu-ter, NHSO₂Pen-n, NHSO₂Hex-n, NHSO₂CF₃, NHSO₂Ph, OCF₂CF₃, OCH₂CF₃, OCH₂CHF₂, OCH₂CH₂F, OCH₂CH₂Cl, OCH₂CH₂Br, OCH₂OMe, OCH₂OEt, OCH₂OPr-n, OCH₂OPr-iso, OCH₂OBu-n, OCH₂OBu-iso, OCH₂OBu-sec, OCH₂OBu-ter, OCH₂CH₂OMe, OCH₂CH₂OEt, OCH₂CH₂OPr-n, OCH₂CH₂CH₂OMe, OCH₂CH₂CH₂OEt, OCH₂CH₂CH₂CH₂OMe, OCH₂SMe, OCH₂SEt, OCH₂SPr-n, OCH₂SPr-iso, OCH₂SBu-n, OCH₂SBu-iso, OCH₂SBu-sec, OCH₂SBu-ter, OCH₂CH₂SMe, OCH₂CH₂SEt, OCH₂CH₂SPr-n, OCH₂CH₂CH₂SMe, OCH₂CH₂CH₂SEt, OCH₂CH₂CH₂CH₂SMe, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter, Pen-

n, Et₂CH, Hex-n, Me(Pr-n)CH, Me(Bu-n)CH, Et(Pr-n)CH, Me₂CHCH₂CH₂, O⁻Na⁺, O⁻K⁺, O⁻Ca²⁺, O⁻NH₄⁺, O⁻N⁺HET₃, O⁻N⁺H(Bu-n)₃, Q16, Q28, Q36, Q43, Q54, Q57, NR⁴R⁵, ON=CR²R³, OCH₂OC(O)R⁶, NHCN

(本発明化合物の置換基 R² および R³ の具体例)

- 5 H, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter, Pen-n, Et₂CH, Hex-n, Me(Pr-n)CH, Me(Bu-n)CH, Et(Pr-n)CH, Me₂CHCH₂CH₂, Ph, 2-Cl-Ph, 3-Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2,4-Cl₂-Ph, 3,5-Cl₂-Ph, 2,6-Cl₂-Ph, 2,3-Cl₂-Ph, 2,5-Cl₂-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph, 4-F-Ph, 2-F-4-Cl-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 4-Br-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-Ph, 2,4-Me₂-Ph, 3,5-Me₂-Ph, 2,6-Me₂-Ph, 2,3-Me₂-Ph,
- 10 2,5-Me₂-Ph, 2-MeO-Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF₃-Ph, 3-CF₃-Ph, 4-CF₃-Ph, 2,4,6-Cl₃-Ph, 2,3,5-Cl₃-Ph, 2,3,4-Cl₃-Ph, 2-NO₂-Ph, 3-NO₂-Ph, 4-NO₂-Ph, 2,4-(NO₂)₂-Ph, 2-CN-Ph, 3-CN-Ph, 4-CN-Ph

(本発明化合物の置換基 R⁴ および R⁵ の具体例)

- H, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter, Pen-n, Et₂CH,
- 15 Hex-n, Me(Pr-n)CH, Me(Bu-n)CH, Et(Pr-n)CH, Me₂CHCH₂CH₂, Pr-cyc, Bu-cyc, Pen-cyc, Hex-cyc, CH₂Pr-cyc, CH₂Bu-cyc, CH₂Pen-cyc, CH₂Hex-cyc, CH₂CH₂Pr-cyc, CH₂CH=CH₂, CH₂CH=CHMe, CH₂CH=CHEt, CH₂CMe=CH₂, CH₂CH₂CH=CH₂, CH₂CH₂CH=CHMe, CH₂CH=CHMe₂, CHMeCH=CH₂, CH₂CMe=CHMe, CHMeCH=CHMe, CH₂CMe=CHEt, CH₂CH₂CH=CMe₂, CH₂CMe=CMe₂, CH₂C≡CH, CH₂C≡CMe, CH₂C≡CEt,
- 20 CH₂CH₂C≡CH, CH₂CH₂C≡CMe, CHMeC≡CH, CHMeC≡CMe, CH₂F, CH₂Cl, CH₂Br, CH₂I, CHF₂, CHCl₂, CHBr₂, CF₃, CCl₃, CBr₃, CClF₂, CBrF₂, CH₂FCH₂, CHF₂CH₂, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CF₃CF₂CF₂, ClCH₂CH₂, BrCH₂CH₂, CCl₃CH₂, CF₃CH₂CH₂, CCl₃CH₂CH₂, ClCH₂CH₂CH₂, FCH₂CH₂CH₂, CF₃CF₂CH₂, ClCH₂CH₂CH₂CH₂, OMe, OEt, OPr-n, OPr-iso, OBu-n, OBu-iso, OBu-sec, OBu-ter, Ph, 2-Cl-Ph, 3-
- 25 Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2,4-Cl₂-Ph, 3,5-Cl₂-Ph, 2,6-Cl₂-Ph, 2,3-Cl₂-Ph, 2,5-Cl₂-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph, 4-F-Ph, 2-F-4-Cl-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 4-Br-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-Ph, 2,4-Me₂-Ph, 3,5-Me₂-Ph, 2,6-Me₂-Ph, 2,3-Me₂-Ph, 2,5-Me₂-Ph, 2-MeO-Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF₃-Ph, 3-CF₃-Ph, 4-CF₃-Ph, 2,4,6-Cl₃-Ph, 2,3,5-Cl₃-Ph, 2,3,4-Cl₃-Ph, 2-NO₂-Ph, 3-NO₂-Ph, 4-NO₂-Ph,

2,4-(NO₂)₂-Ph, 2-CN-Ph, 3-CN-Ph, 4-CN-Ph, PhCH₂

(本発明化合物の置換基 R⁴ および R⁵ が結合している窒素原子とともに 3 ~ 9 員環を構成する場合の具体例)

A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16,
5 A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30,
A31, A32, A33, A34, A35, A36, A37

(本発明化合物の置換基 R⁶ の具体例)

Ph, 2-Cl-Ph, 3-Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2,4-Cl₂-Ph, 3,5-Cl₂-Ph, 2,6-Cl₂-Ph, 2,3-
Cl₂-Ph, 2,5-Cl₂-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph, 4-F-Ph, 2-F-4-Cl-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-
10 Ph, 4-Br-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-Ph, 2,4-Me₂-Ph, 3,5-Me₂-Ph, 2,6-Me₂-
-Ph, 2,3-Me₂-Ph, 2,5-Me₂-Ph, 2-MeO-Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF₃-Ph, 3-
CF₃-Ph, 4-CF₃-Ph, 2,4,6-Cl₃-Ph, 2,3,5-Cl₃-Ph, 2,3,4-Cl₃-Ph, 2-NO₂-Ph,
3-NO₂-Ph, 4-NO₂-Ph, 2,4-(NO₂)₂-Ph, 2-CN-Ph, 3-CN-Ph, 4-CN-Ph, PhCH₂, 2-
Cl-PhCH₂, 3-Cl-PhCH₂, 4-Cl-PhCH₂, 2,4-Cl₂-PhCH₂, 3,5-Cl₂-PhCH₂, 2,6-Cl₂-
15 PhCH₂, 2,3-Cl₂-PhCH₂, 2,5-Cl₂-PhCH₂, 2-F-PhCH₂, 3-F-PhCH₂, 4-F-PhCH₂,
2-F-4-Cl-PhCH₂, 2-Br-PhCH₂, 3-Br-PhCH₂, 4-Br-PhCH₂, 2-Me-PhCH₂, 3-Me-
PhCH₂, 4-Me-PhCH₂, 2,4-Me₂-PhCH₂, 3,5-Me₂-PhCH₂, 2,6-Me₂-PhCH₂, 2,3-Me₂-
-PhCH₂, 2,5-Me₂-PhCH₂, 2-MeO-PhCH₂, 3-MeO-PhCH₂, 4-MeO-PhCH₂, 2-CF₃-
PhCH₂, 3-CF₃-PhCH₂, 4-CF₃-PhCH₂, PhCHMe, 2-Cl-PhCHMe, 3-Cl-PhCHMe, 4-
20 Cl-PhCHMe, 2,4-Cl₂-PhCHMe, 3,5-Cl₂-PhCHMe, 2,6-Cl₂-PhCHMe, 2,3-Cl₂-
PhCHMe, 2,5-Cl₂-PhCHMe, 2-F-PhCHMe, 3-F-PhCHMe, 4-F-PhCHMe, 2-F-4-Cl-
PhCHMe, 2-Br-PhCHMe, 3-Br-PhCHMe, 4-Br-PhCHMe, 2-Me-PhCHMe, 3-Me-PhCHMe,
4-Me-PhCHMe, 2,4-Me₂-PhCHMe, 3,5-Me₂-PhCHMe, 2,6-Me₂-PhCHMe, 2,3-Me₂-
PhCHMe, 2,5-Me₂-PhCHMe, 2-MeO-PhCHMe, 3-MeO-PhCHMe, 4-MeO-PhCHMe, 2-CF₃-
25 -PhCHMe, 3-CF₃-PhCHMe, 4-CF₃-PhCHMe, PhCMe₂, 2-Cl-PhCMe₂, 3-Cl-PhCMe₂,
4-Cl-PhCMe₂, 2,4-Cl₂-PhCMe₂, 3,5-Cl₂-PhCMe₂, 2,6-Cl₂-PhCMe₂, 2,3-Cl₂-
PhCMe₂, 2,5-Cl₂-PhCMe₂, 2-F-PhCMe₂, 3-F-PhCMe₂, 4-F-PhCMe₂, 2-F-4-Cl-
PhCMe₂, 2-Br-PhCMe₂, 3-Br-PhCMe₂, 4-Br-PhCMe₂, 2-Me-PhCMe₂, 3-Me-PhCMe₂,
4-Me-PhCMe₂, 2,4-Me₂-PhCMe₂, 3,5-Me₂-PhCMe₂, 2,6-Me₂-PhCMe₂, 2,3-Me₂-

PhCMe₂, 2,5-Me₂-PhCMe₂, 2-MeO-PhCMe₂, 3-MeO-PhCMe₂, 4-MeO-PhCMe₂, 2-CF₃-PhCMe₂, 3-CF₃-PhCMe₂, 4-CF₃-PhCMe₂, 1-Naph, 2-Naph

(本発明化合物の置換基 R⁷ の具体例)

- H, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter, Pen-n, Et₂CH,
 5 Hex-n, Me(Pr-n)CH, Me(Bu-n)CH, Et(Pr-n)CH, Me₂CHCH₂CH₂, Pr-cyc, Bu-cyc,
 Pen-cyc, Hex-cyc, CH₂CH=CH₂, CH₂CH=CHMe, CH₂CH=CHEt, CH₂CMe=CH₂, CH₂CH₂
 CH=CH₂, CH₂CH₂CH=CHMe, CH₂CH=CMe₂, CHMeCH=CH₂, CH₂CMe=CHMe, CHMeCH=CHMe,
 CH₂CMe=CHEt, CH₂CH₂CH=CMe₂, CH₂CMe=CMe₂, CH₂C≡CH, CH₂C≡CMe, CH₂C≡CEt,
 CH₂CH₂C≡CH, CH₂CH₂C≡CMe, CHMeC≡CH, CHMeC≡CMe, CH₂F, CH₂Cl, CH₂Br,
 10 CH₂I, CHF₂, CHCl₂, CHBr₂, CF₃, CCl₃, CBr₃, CClF₂, CBrF₂, CH₂FCH₂, CHF₂
 CH₂, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CF₃CF₂CF₂, ClCH₂CH₂, BrCH₂CH₂, CCl₃CH₂, CF₃CH₂CH₂,
 CCl₃CH₂CH₂, ClCH₂CH₂CH₂, FCH₂CH₂CH₂, CF₃CF₂CH₂, ClCH₂CH₂CH₂CH₂

(本発明化合物の置換基 R⁸ の具体例)

- H, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter, Pen-n, Et₂CH,
 15 Hex-n, Me(Pr-n)CH, Me(Bu-n)CH, Et(Pr-n)CH, Me₂CHCH₂CH₂

(本発明化合物の置換基 R⁹ および R¹⁰ の具体例)

Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter, Pen-n, Et₂CH, Hex-n,
 Me(Pr-n)CH, Me(Bu-n)CH, Et(Pr-n)CH, Me₂CHCH₂CH₂

(本発明化合物の置換基 R⁹ および R¹⁰ が結合している酸素原子または硫黄原子

- 20 とともに5または6員環を構成する場合の具体例)

B1, B2, B3, B4, B5, B6, B7, B8

(本発明化合物の置換基 R¹¹ の具体例)

H, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter, Pen-n, Et₂CH,
 Hex-n, Me(Pr-n)CH, Me(Bu-n)CH, Et(Pr-n)CH, Me₂CHCH₂CH₂

- 25 (本発明化合物の置換基 R¹² の具体例)

H, CHO, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter

(本発明化合物の置換基 X および Y の具体例)

H, Me, Et, Pr-n, Pr-iso, Bu-n, Bu-iso, Bu-sec, Bu-ter, OMe, OEt, OPr-n,
 OPr-iso, OBu-n, OBu-iso, OBu-sec, OBu-ter, CH₂F, CH₂Cl, CH₂Br, CH₂I,

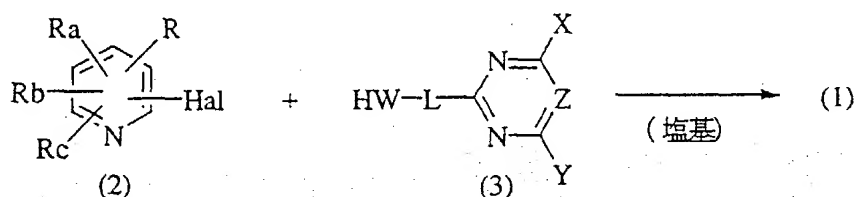
CHF₂, CHCl₂, CHBr₂, CF₃, CCl₃, CBr₃, CClF₂, CBrF₂, CH₂FCH₂, CHF₂CH₂, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CF₃CF₂CF₂, ClCH₂CH₂, BrCH₂CH₂, CCl₃CH₂, CF₃CH₂CH₂, CCl₃CH₂CH₂, ClCH₂CH₂CH₂, FCH₂CH₂CH₂, CF₃CF₂CH₂, ClCH₂CH₂CH₂CH₂, OCH₂F, OCH₂Cl, OCH₂Br, OCH₂I, OCHF₂, OCHCl₂, OCHBr₂, OCF₃, OCCl₃, OCB₃, OCClF₂, OCB₃F₂, OCH₂FCH₂, OCHF₂CH₂, OCF₃CH₂, OCF₃CF₂, OCF₃CF₂CF₂, ClCH₂CH₂O, BrCH₂CH₂O, CCl₃CH₂O, CF₃CH₂CH₂O, CCl₃CH₂CH₂O, ClCH₂CH₂CH₂O, FCH₂CH₂CH₂O, CF₃CF₂CH₂O, ClCH₂CH₂CH₂CH₂O, F, Cl, Br, I

(本発明化合物の置換基Lの具体例)

CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂, CHMe, CH₂Me, CHMeCH₂, CH₂CHMe

- 10 本発明化合物(1)は下記の反応式1から14のいずれかを選ぶことにより容易に製造できる。

(反応式1)



式中、R、Ra、Rb、Rc、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表し、Halはハロゲン原子を表す。

- 15 反応式1は、ハロゲノピリジン類(2)を塩基存在下あるいは非存在下、ピリジン類あるいはトリアジン類(3)と反応させて本発明化合物(1)を製造する方法を示す。

(3)は(2)に対して通常0.5から5倍モル、好ましくは0.8から2倍モル使用する。

- 20 塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムおよび水素化ナトリウム等の無機塩基類、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリンおよび1,8-ジアザビスクロ〔5.4.0〕-7-ウンデセン(DBU)等の有機塩基類、n-ブチルリチウムおよびsec-ブチルリチウム等の有機リチウム類、リチウムジイソプロピルアミドおよびリチウムビストリメチルシリルアミド等の有機リチウムア
- 25

ミド類、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドおよびカリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類があげられる。

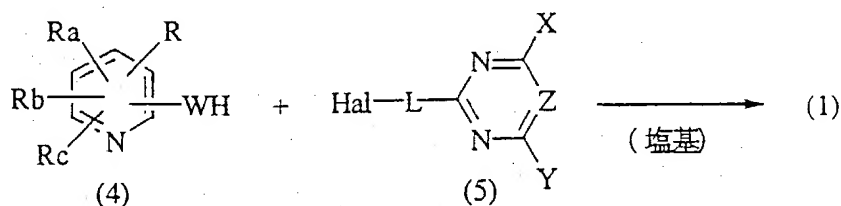
塩基は(2)に対して通常0から10倍モル、好ましくは0.5から2倍モル使用する。

- 5 本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼンおよびトルエン等の炭化水素類、四塩化炭素、クロロホルムおよび1,2-ジクロロエタン等のハロゲン系炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、
- 10 メチルエチルケトンおよびメチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリルおよびプロピオニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミドおよびN,N-ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシドおよびスルホラン等の含硫黄極性溶媒類、ヘキサメチルホスホロアミドおよびヘキサメチルホスホラストリアミド等の含リン極性溶媒類、ピリジンおよびキノリン等の
- 15 有機塩基類があげられる。

反応温度は通常-90から200℃、好ましくは0から120℃である。

反応時間は通常0.05から100時間、好ましくは0.5から10時間である。

(反応式2)



- 20 式中、R、Ra、Rb、Rc、W、L、X、Y、ZおよびHalは前記と同様の意味を表す。

反応式2は、ピリジン類(4)を塩基存在下あるいは非存在下、ピリミジン類あるいはトリアジン類(5)と反応させて本発明化合物(1)を製造する方法を示す。

- 25 (5)は(4)に対して通常0.5から5倍モル、好ましくは0.8から2倍モ

ル使用する。

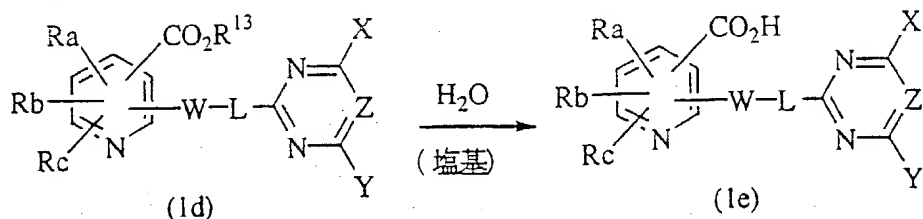
- 塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムおよび水素化ナトリウム等の無機塩基類、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジメチルアニリンおよびDBU等の有機塩基類、n-ブチルリチウムおよびsec-ブチルリチウム等の有機リチウム類、リチウムジイソプロピルアミドおよびリチウムビストリメチルシリルアミド等の有機リチウムアミド類、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドおよびカリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類があげられる。
- 塩基は(2)に対して通常0から10倍モル、好ましくは0.5から2倍モル使用する。

- 本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼンおよびトルエン等の炭化水素類、四塩化炭素、クロロホルムおよび1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンおよびメチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリルおよびプロピオニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミドおよびN, N-ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシドおよびスルホラン等の含硫黄極性溶媒類、ヘキサメチルホスホラアミドおよびヘキサメチルホスホラストリアミド等の含リン極性溶媒類、ピリジンおよびキノリン等の有機塩基類があげられる。

反応温度は通常-90から200℃、好ましくは0から120℃である。

反応時間は通常0.05から100時間、好ましくは0.5から10時間である。

- (反応式3)



式中、R_a、R_b、R_c、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表し、R¹³はC₁₋₆アルキル基またはフェニル基を表す。

反応式3は、本発明化合物(1)の一部である(1d)を加水分解して本発明化合物(1)の一部である(1e)を製造する方法を示す。

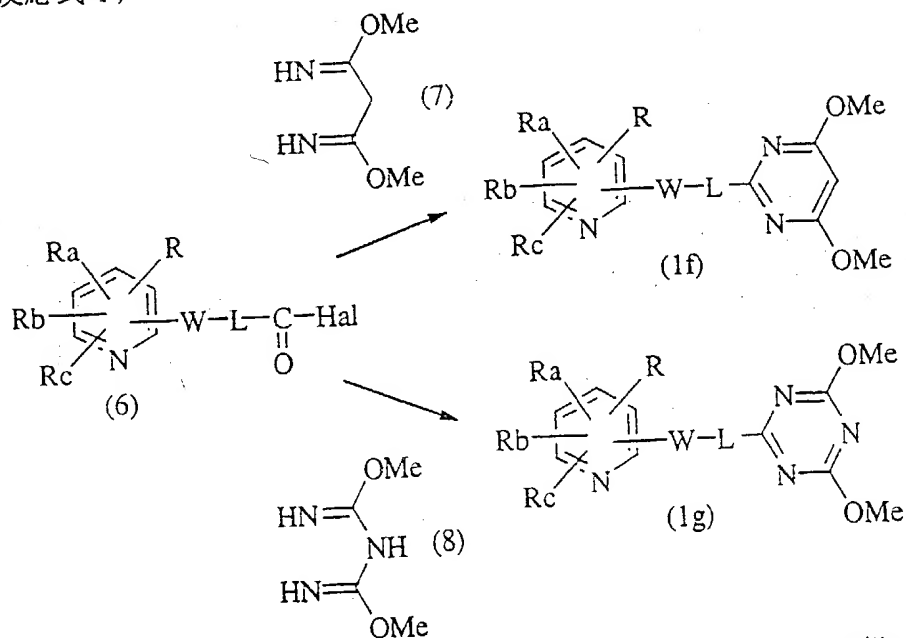
5 塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウムおよび炭酸ナトリウム等の無機塩基類があげられる。

本反応は水中で進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、メタノール、エタノールおよびエチレングリコール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼンおよびトルエン等の炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンおよびメチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリルおよびプロピオニトリル等のニトリル類があげられる。

反応温度は通常-90から200℃、好ましくは0から120℃である。

15 反応時間は通常0.05から100時間、好ましくは0.5から10時間である。

(反応式4)



式中、R、R_a、R_b、R_c、W、LおよびHalは前記と同様の意味を表

す。

反応式4は、カルボン酸ハライド類(6)をイミデート類(7)または(8)と反応させて、各々対応する本発明化合物(1)の一部である(1f)または(1g)を製造する方法を示す。

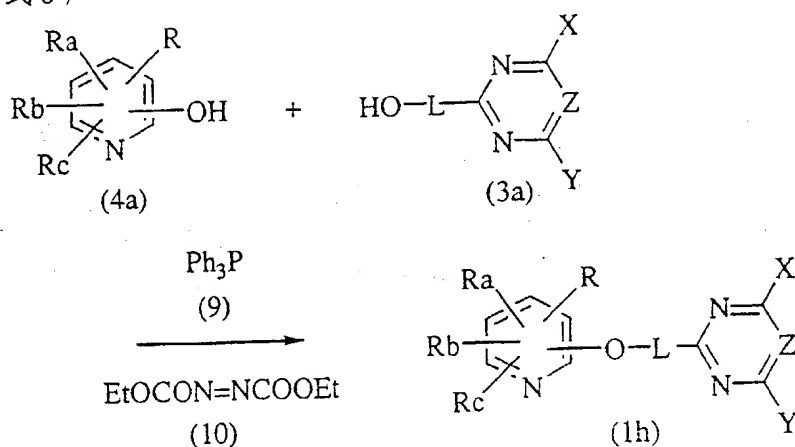
(7)または(8)は(6)に対して0.5から5倍モル、好ましくは0.8から2倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼンおよびトルエン等の炭化水素類、四塩化炭素、塩化メチレン、クロロホルムおよび1,2-ジクロロエタン等のハロゲン系炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンおよびメチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリルおよびプロピオニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミドおよびN,N-ジメチルアセトアミド等の酸アミド類があげられる。

反応温度は通常-90から200℃、好ましくは-20から80℃である。

反応時間は通常0.05から100時間、好ましくは0.5から10時間である。

(反応式5)



式中、R、Ra、Rb、Rc、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表す。

反応式5は、ヒドロキシピリジン類(4a)をトリフェニルホスフィン(9)

とアゾジカルボン酸エチル (10) 存在下、アルコール類 (3 a) と反応させて本発明化合物 (1) の一部である (1 h) を製造する方法を示す。

(3 a) は (4 a) に対して通常 1 から 10 倍モル、好ましくは 1 から 2 倍モル使用する。

5 (9) は (4 a) に対して通常 1 から 10 倍モル、好ましくは 1 から 2 倍モル使用する。

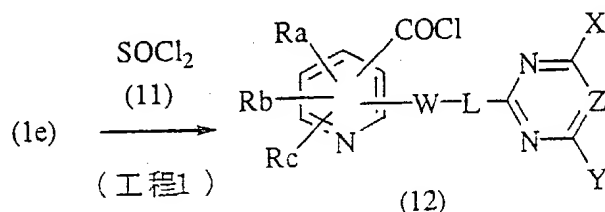
(10) は (4 a) に対して通常 1 から 10 倍モル、好ましくは 1 から 2 倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応
10 に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼンおよびトルエン等の炭化水素類、四塩化炭素、塩化メチレン、クロロホルムおよび 1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンおよびメチルイソブチルケトン等のケトン
15 類、アセトニトリルおよびプロピオニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミドおよび N, N-ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシドおよびスルホラン等の含硫黄極性溶媒類、ヘキサメチルホスホロアミド等の含リン極性溶媒類、ピリジン等の有機塩基類があげられる。

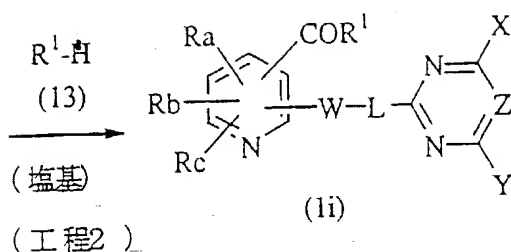
反応温度は通常 -90 から 200℃、好ましくは -40 から 120℃である。

20 反応時間は通常 0.05 から 100 時間、好ましくは 0.5 から 10 時間である。

(反応式 6)



35



式中、R_a、R_b、R_c、R¹、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表す。

反応式6は本発明化合物(1)の一部であるカルボン酸類(1e)を塩化チオニル(11)と反応させてカルボン酸クロリド類(12)とした後、求核試薬(13)と反応させることにより本発明化合物(1)の一部である(ii)を製造する方法を示す。

(工程1)では、(11)は(1e)に対して通常1から100倍モル、好ましくは1から2倍モル使用される。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼンおよびトルエン等の炭化水素類、四塩化炭素、塩化メチレン、クロロホルムおよび1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン等のエーテル類があげられる。

反応温度は通常-40から200℃、好ましくは0から120℃である。

反応時間は通常0.05から100時間、好ましくは0.5から10時間である。

(工程2)では、(13)は(12)に対して通常1から10倍モル、好ましくは1から2倍モル使用される。

塩基は(12)に対して通常0から10倍モル、好ましくは0から2倍モル使用される。

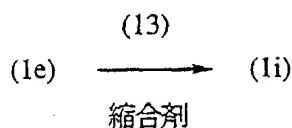
塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムおよび水素化ナトリウム等の無機塩基類、ピリジン、4-ジメチルアニロピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジメチルアニリンおよびDBU等の有機塩基類があげられる。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼンおよびトルエン等の炭化水素類、四塩化炭素、塩化メチレン、クロロホルムおよび1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンおよびメチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリルおよびプロピオニトリル等のニトリル類、ピリジン等の有機塩基類があげられる。

反応温度は通常-90から200℃、好ましくは-40から120℃である。

反応時間は通常0.05から100時間、好ましくは0.5から10時間である。

(反応式7)

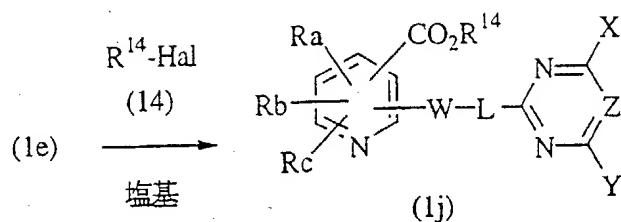


反応式7は本発明化合物(1)の一部であるカルボン酸類(1e)を縮合剤存在下、求核試薬(13)と反応させることにより本発明化合物(1)の一部である(1i)を製造する方法を示す。

本反応に使用される縮合剤としては、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、N-エチル-N'-3-ジメチルアミノプロピルカルボジイミド、N-エチル-N'-3-ジメチルアミノプロピルカルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類、ベンゾトリアゾール-1-イルートリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロリン化物塩、ジフェニルホスホリルアミド、フェニルホスホン酸ビス(2-ニトロフェニルエステル)等のリン酸系化合物、カルボニルジイミダゾール、2-エトキシ-1-エトキシカルボニル-1, 2-ジヒドロキノリン等の複素環アミド系化合物があげられる。これらの縮合剤は単独あるいはN-ヒドロキシスクシンイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールあるいは3-ヒドロキシ-4-オキソ-3, 4-ジヒドロ-1, 2, 3-ベンゾトリアジン等の添加剤と組み合わせて使用できる。また、トリフェニルホス

フィンと四塩化炭素の組み合わせも本反応の縮合剤として使用できる。

(反応式 8)



式中、R a、R b、R c、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表し、R¹⁴はC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、ベンジル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、ハロゲン原子によって置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基によって置換されたC₁₋₆アルキル基またはC₁₋₆アルキルチオ基によって置換されたC₁₋₆アルキル基を表す。

- 5 反応式 8 は本発明化合物 (1) の一部であるカルボン酸類 (1 e) と求電子試薬 (1 4) を塩基存在下、反応させることにより本発明化合物 (1) の一部である (1 j) を製造する方法を示す。

(1 4) は (1 e) に対して通常 1 から 10 倍モル、好ましくは 1 から 2 倍モル使用する。

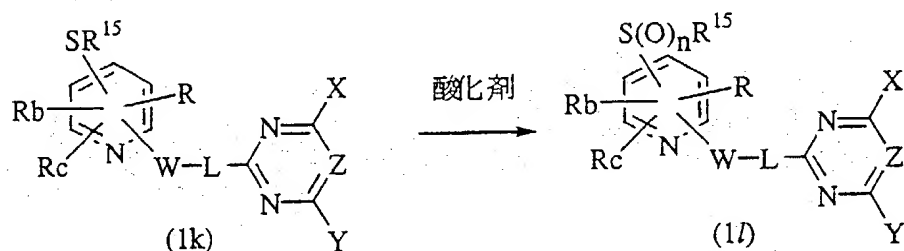
- 15 塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムおよび水素化ナトリウム等の無機塩基類、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジメチルアニリンおよび DBU 等の有機塩基類、n-ブチルリチウムおよび sec-ブチルリチウム等の有機リチウム類、リチウムジイソプロピルアミドおよびリチウムビストリメチルシリルアミド等の有機リチウムアミド類、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドおよびカリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類があげられる。

- 20 塩基は (1 e) に対して通常 0 から 10 倍モル、好ましくは 0.5 から 2 倍モル使用する。

- 本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応-
25 に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、

- ベンゼンおよびトルエン等の炭化水素類、四塩化炭素、クロロホルムおよび1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン系炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンおよびメチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリルおよびプロピオニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミドおよびN, N-ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシドおよびスルホラン等の含硫黄極性溶媒類、ヘキサメチルホスホロアミドおよびヘキサメチルホスホラストリアミド等の含リン極性溶媒類、ピリジンおよびキノリン等の有機塩基類があげられる。
- 5 反応温度は通常-90から200℃、好ましくは0から120℃である。
- 10 反応時間は通常0.05から100時間、好ましくは0.5から10時間である。

(反応式9)

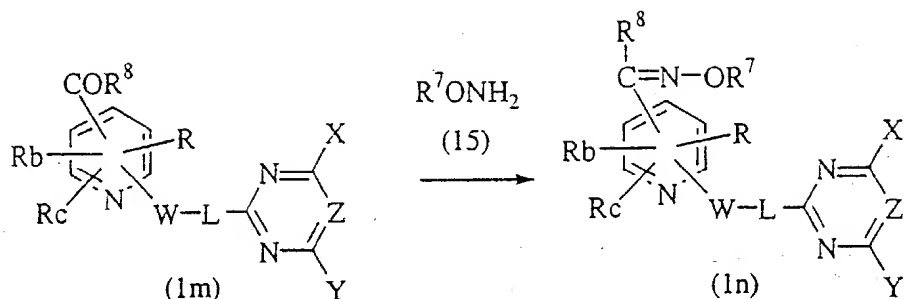


- 15 式中、R、Rb、Rc、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表し、R¹⁵はC₁₋₆アルキル基またはフェニル基（C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）を表し、nは1または2を表す。

- 20 反応式9は本発明化合物(1)の一部であるスルフィド類(1k)と酸化剤を反応させることにより本発明化合物(1)の一部であるスルホキシド類またはスルホン類(1l)を製造する方法を示す。

本反応に使用される酸化剤としては、過酢酸、m-クロロ過安息香酸等の過カルボン酸類、過酸化水素水、過マンガン酸カリウム、過硫酸塩（例えば、2KHSO₅・KHSO₄・K₂SO₄）等の無機酸化剤があげられる。

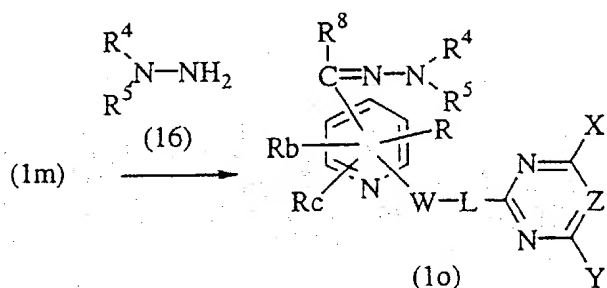
(反応式 10)



式中、R、Rb、Rc、R⁷、R⁸、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表す。

反応式 10 は本発明化合物 (1) の一部であるアルデヒド類またはケトン類 (1m) とアルコキシアミン類 (15) を反応させることにより本発明化合物 (1) の一部であるオキシム類 (1n) を製造する方法を示す。

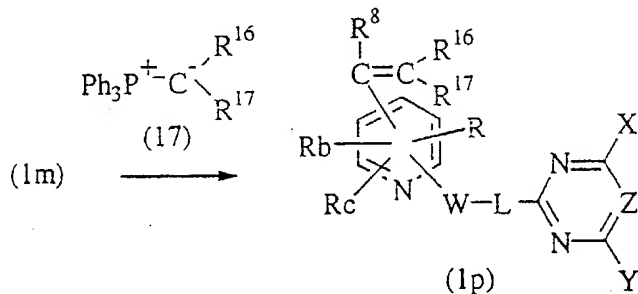
(反応式 11)



式中、R、Rb、Rc、R⁴、R⁵、R⁸、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表す。

10 反応式 11 は本発明化合物 (1) の一部であるアルデヒド類またはケトン類 (1m) とヒドラジン類 (16) を反応させることにより本発明化合物 (1) の一部であるヒドラゾン類 (1o) を製造する方法を示す。

(反応式 12)

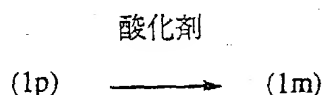


式中、R、Rb、Rc、R⁸、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味

を表し、 R^{16} および R^{17} は各々独立して水素原子または C_{1-4} アルキル基を表す。

- 反応式 12 は本発明化合物 (1) の一部であるアルデヒド類またはケトン類 (1m) とリンイリド類 (17) を反応させることにより本発明化合物 (1) の一部であるアルケン類 (1p) を製造する方法を示す。

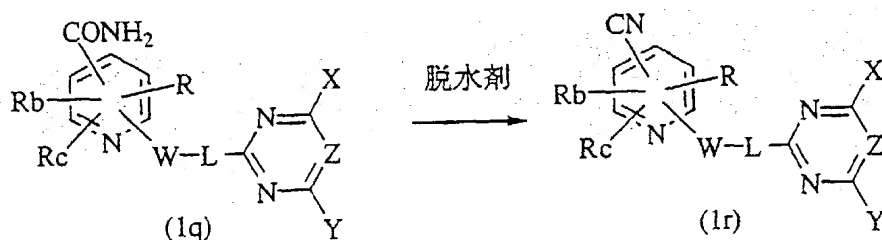
(反応式 13)



反応式 13 は本発明化合物 (1) の一部であるアルケン類 (1p) を酸化剤と反応させることにより、本発明化合物 (1) の一部であるアルデヒド類またはケトン類 (1m) を製造する方法を示す。

- 10 本反応に使用される酸化剤としては、オゾン、四酸化オスミウム等があげられる。

(反応式 14)



式中、R、Rb、Rc、W、L、X、YおよびZは前記と同様の意味を表す。

- 15 反応式 14 は本発明化合物 (1) の一部であるアミド類 (1q) を脱水して本発明化合物 (1) の一部であるニトリル類 (1r) を製造する方法を示す。

本反応に使用される脱水剤としては、五酸化リン、五塩化リン、オキシ塩化リン、塩化チオニル、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸、ホスゲン等があげられる。これらの脱水剤は単独で、または組み合わせて使用でき、トリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基と組みあわせることにより、好結果が得られる場合がある。

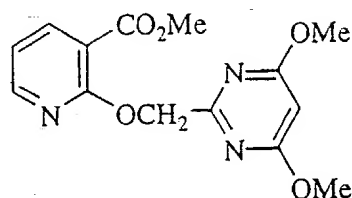
- 20 他に、ジシクロヘキシルカルボジイミド等の縮合剤あるいはトリフェニルホスフィン-四塩化炭素、水酸化ナトリウム-クロロホルム等の組み合わせを使用する方法もある。

以下に本発明化合物の合成例を実施例および参考例として具体的に述べるが、

本発明はこれらに限定されるものではない。

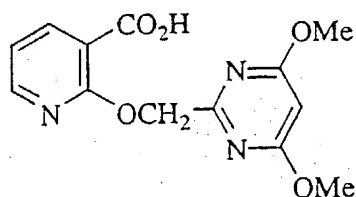
(実施例 1)

(1) 2-((4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル (本発明化合物 No. 1a-7) の合成



- 5 トルエン 10 ml に 60% 水素化ナトリウム 0.28 g (7.1 mmol) を懸濁させ、氷冷しながら 2-ヒドロキシメチル-4, 6-ジメトキシピリミジン 1.0 g (5.9 mmol) を加え、0.5 時間攪拌した。2-クロロピリジン-3-カルボン酸メチル 1.0 g (5.9 mmol) を加え、0.5 時間還流した。室温まで冷却後、得られたトルエン溶液を炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥、溶媒溜去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘキサン/ジエチルエーテル = 1/1) にて精製し、目的物 1.1 g を得た。融点 107-109℃。
- 10

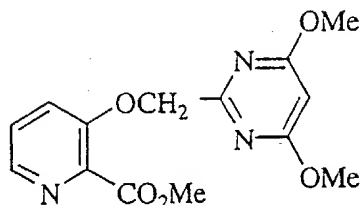
- (2) 2-((4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸 (本発明化合物 No. 1a-6) の合成
- 15



- メタノール 10 ml に 2-((4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル 0.88 g (2.9 mmol) を溶解し、2N 水酸化ナトリウム水溶液 3.0 ml を加え、0.5 時間還流した。水 10 ml を加え、ジエチルエーテルで洗浄後、得られた水層に 35% 塩酸を加えて酸性にし、析出した固体を濾取、水洗、乾燥して、目的物 0.72 g を得た。融点 164-165℃。
- 20

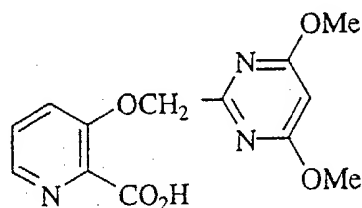
(実施例 2)

(1) 3-((4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル) メトキシ) ピリジン-2-カルボン酸メチル (本発明化合物 No. 1c-2) の合成



N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml に 60% 水素化ナトリウム 0.17 g (4.3 mmol) を懸濁させ、氷冷しながら 3-ヒドロキシピリジン-2-カルボン酸メチル 0.66 g (4.3 mmol) を加え、0.25 時間攪拌した。2-クロロメチル-4, 6-ジメトキシピリミジン 0.81 g (4.3 mmol) を加え、70℃ にて 2 時間攪拌した。室温まで冷却後、水 20 ml を加え、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を水および塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、溶媒溜去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘキサン/ジエチルエーテル = 1/1) にて精製し、目的物 1.1 g を得た。融点 68-70℃。

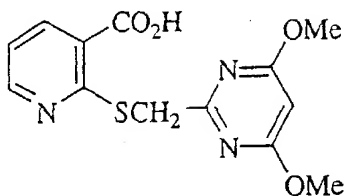
(2) 3-((4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル) メトキシ) ピリジン-2-カルボン酸 (本発明化合物 No. 1c-1) の合成



メタノール 10 ml に 3-((4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル) メトキシ) ピリジン-2-カルボン酸メチル 0.43 g (1.4 mmol) を溶解し、2N 水酸化ナトリウム水溶液 3.0 ml を加え、室温にて 1 時間攪拌した。35% 塩酸を加えて酸性にした後、減圧下濃縮し析出した固体を濾取、水洗、乾燥して、目的物 0.23 g を得た。融点 94-99℃。

(実施例 3)

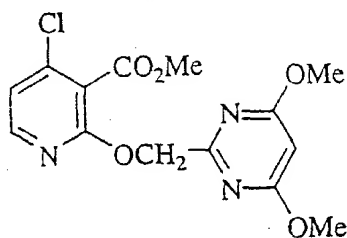
2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチルチオ)ピリジン-3-カルボン酸(本発明化合物No. 1a-5)の合成



アセトニトリル10mlに2-メルカプトピリジン-3-カルボン酸0.60g(3.9mmol)、2-クロロメチル-4,6-ジメトキシピリミジン0.73g(3.9mmol)と無水炭酸カリウム0.64g(4.6mmol)を加え、室温にて12時間攪拌した。析出した固体が溶解するまで炭酸水素ナトリウム飽和水溶液を加え、得られた水溶液をジエチルエーテルにて洗浄し、35%塩酸を加えて析出した固体を濾取、水洗、乾燥して、目的物0.61gを得た。融点194-198℃。

10 (実施例4)

(1) 4-クロロ-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル(本発明化合物No. 1a-86)の合成

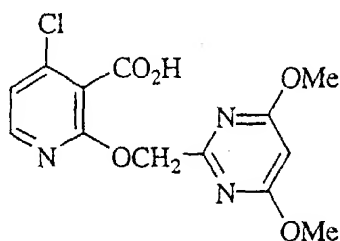


テトラヒドロフラン30mlに4-クロロ-2-ヒドロキシピリジン-3-カルボン酸メチル0.96g(5.4mmol)とトリフェニルホスフィン2.82g(10.8mmol)を加えた。次に氷冷しながら2-ヒドロキシメチル-4,6-ジメトキシピリミジン1.05g(5.9mmol)とアゾジカルボン酸ジエチル1.87g(10.8mmol)を加え、室温にて4時間攪拌した。

1N塩酸30mlを加え、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、溶媒溜去した。得られた残渣にジエチルエーテルを加え、不溶物を濾別後、

濾液を濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝4／1）にて精製し、目的物0.20gを得た。油状物質。

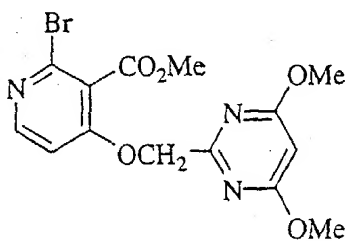
- (2) 4-クロロ-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸（本発明化合物No. 1a-87）の合成



- メタノール5mlに4-クロロ-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル0.18g(0.53mmol)を溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液2.5mlを加え、1時間還流した。水20mlを加え、酢酸エチルで洗浄した。得られた水層に35%塩酸を加えて酸性にした後、クロロホルムにて抽出操作をおこなった。得られたクロロホルム溶液を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄、乾燥して、目的物0.10gを得た。融点138-142℃。

（実施例5）

- 2-ブロモ-4-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル（本発明化合物No. 1b-3）の合成

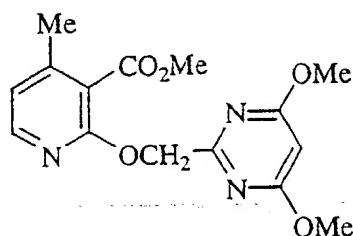


- アセトニトリル20mlに2-ブロモ-4-ヒドロキシピリジン-3-カルボン酸メチル2.64g(11.4mmol)、2-クロロメチル-4,6-ジメトキシピリミジン2.15g(11.4mmol)と無水炭酸カリウム1.58g(11.4mmol)を加え、1時間還流した。室温まで冷却後、水50mlを加え、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を塩化

ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、溶媒溜去した。得られた残渣にクロロホルムを加え、不溶物を濾別後、濾液を濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝2／1）にて精製し、目的物2.31gを得た。融点102-104℃。

5 (実施例6)

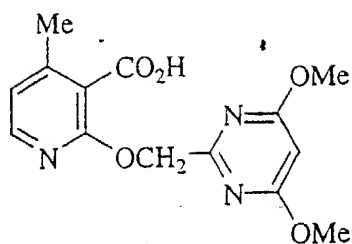
(1) 4-メチル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル（本発明化合物No. 1a-24）の合成



トルエン15mlに60%水素化ナトリウム0.33g (8.1mmol)を懸濁させ、氷冷しながら2-ヒドロキシメチル-4,6-ジメトキシピリジン1.4g (8.1mmol)を加え、0.5時間攪拌した。2-クロロ-4-メチルピリジン-3-カルボン酸メチル1.5g (8.1mmol)を加え、80℃にて5時間加熱攪拌した。室温まで冷却後、水20mlを加え、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥、溶媒溜去した。得られた残渣をn-ヘキサン／ジイソプロピルエーテル＝10／1の混合溶媒に溶解させ、不溶物を濾別した。得られた濾液を濃縮し、残渣を高速液体クロマトグラフィー（ODSカラム、移動相：アセトニトリル／水／酢酸＝3／1／0.004）にて分離精製し、目的物1.02gを得た。油状物質。

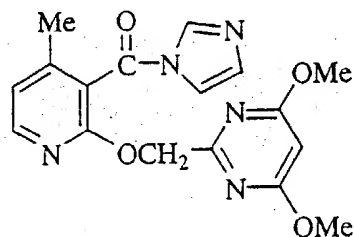
(2) 4-メチル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸（本発明化合物No. 1a-9）の合成

46



メタノール 10 ml に 4-メチル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル 0.22 g (0.69 mmol) を溶解し、2N 水酸化ナトリウム水溶液 3.0 ml を加え、1 時間還流した。メタノールを溜去した後、水 20 ml を加え、ジエチルエーテルで洗浄した。得られた水層に 35% 塩酸を加えて析出した固体を濾取、水洗、乾燥して、目的物 0.14 g を得た。融点 135-138℃。

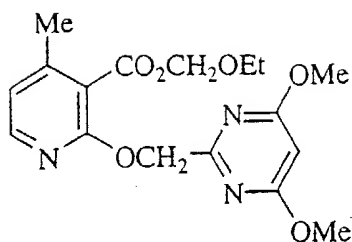
(3) 1-イミダゾリル 4-メチル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)-3-ピリジル ケトン (本発明化合物 No. 1a-56) の合成



ベンゼン 8 ml に 4-メチル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸 0.50 g (1.64 mmol) と塩化チオニル 2 ml を加え、0.5 時間還流した。溶媒溜去して得られた残渣をテトラヒドロフラン 10 ml に溶解させ、イミダゾール 0.19 g (2.0 mmol) とトリエチルアミン 0.20 g (2.0 mmol) を溶解したテトラヒドロフラン 10 ml 溶液に滴下した。室温で 3 時間攪拌後、酢酸エチル 50 ml を加え、水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥、溶媒溜去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: ジエチルエーテル) にて精製し、目的物 0.30 g を得た。油状物質。

(4) 4-メチル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸エトキシメチル (本発明化合物 No. 1a-2

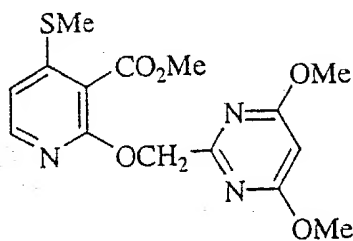
9) の合成



アセトニトリル 1.0 ml に 4-メチル-2-((4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸 0.15 g (0.49 mmol)、無水炭酸カリウム 0.10 g (0.74 mmol) とクロロメチルエチルエーテル 0.07 g (0.74 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。
酢酸エチル 50 ml を加え、水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、溶媒溜去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：クロロホルム）にて精製し、目的物 0.17 g を得た。油状物質。

10 (実施例 7)

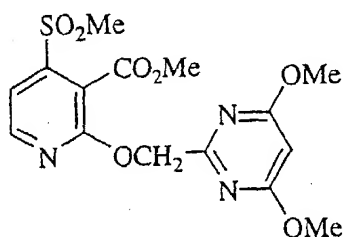
(1) 4-メチルチオ-2-((4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル（本発明化合物 No. 1a-27）の合成



トルエン 15 ml に 60% 水素化ナトリウム 0.23 g (5.7 mmol) を懸濁させ、氷冷しながら 2-ヒドロキシメチル-4, 6-ジメトキシピリミジン 1.0 g (5.7 mmol) を加え、0.3 時間攪拌した。2-ブロモ-4-メチルチオピリジン-3-カルボン酸メチル 1.5 g (5.7 mmol) を加え、80℃にて 4 時間加熱攪拌した。室温まで冷却後、水 20 ml を加え、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥、溶媒溜去した。得られた残渣を高

速液体クロマトグラフィー（ODSカラム、移動相：アセトニトリル／水／酢酸＝3／1／0.004）にて分離精製し、目的物0.84gを得た。融点108－111℃。

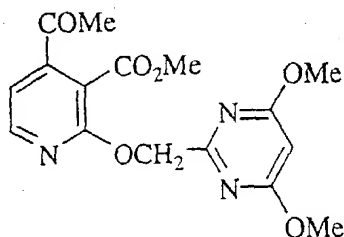
5 (2) 4-メチルスルホニル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル（本発明化合物No. 1a-28）の合成



クロロホルム15mlに4-メチルチオ-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル0.40g (1.1mmol)を溶解し、m-クロロ過安息香酸0.59g (3.4mmol)を加えて、40℃にて1.5時間攪拌した。クロロホルム30mlを追加し、10%亜硫酸水素ナトリウム飽和水溶液、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄した。得られたクロロホルム溶液を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒溜去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：クロロホルム）にて精製し、目的物0.40gを得た。油状物質。

15 (実施例8)

4-アセチル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル（本発明化合物No. 1a-91）の合成



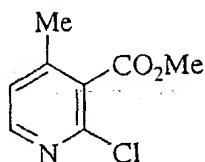
テトラヒドロフラン15mlに4-イソプロペニル-2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メトキシ)ピリジン-3-カルボン酸メチル0.32g (0.93mmol)を溶解し、水14ml、4%四酸化オスミウム水溶

20

- 液 0.20 ml と過ヨウ素酸ナトリウム 0.44 g (2.1 mmol) を加え、室温にて 36 時間攪拌した。反応混合物を水 50 ml にあけ、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を 10% 亜硫酸水素ナトリウム水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲル薄層クロマトグラフィー（展開液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝7／10）にて精製し、目的物 0.02 g を得た。油状物質。

（参考例 1）

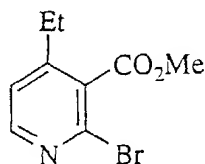
- 2-クロロ-4-メチルピリジン-3-カルボン酸メチルの合成（化合物 No. 2a-1）



- 10% 塩化水素酸酢酸溶液 100 ml に 2-シアノ-5-ジメチルアミノ-3-メチル-2,4-ペンタジエン酸メチル 10.0 g (51.5 mmol) を加え、室温にて 5 日間攪拌した。反応混合物を氷水 500 ml に投入し、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を水、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：クロロホルム）にて精製し、目的物 5.25 g を得た。油状物質。

（参考例 2）

- 2-ブロモ-4-エチルピリジン-3-カルボン酸メチルの合成（化合物 No. 2a-2）

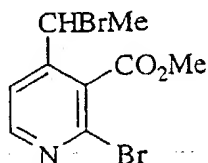


メタノール 160 ml に 2-シアノ-3-メチル-2-ペンテン酸メチル 40.4 g (264 mmol) と N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 38.0 g (319 mmol) を加え、5 時間還流した。減圧下、メタノールを溜

去した後、酢酸300mlと25%臭化水素酸酢酸溶液264gを加え、室温にて30時間攪拌した。反応混合物を氷水1000mlに投入し、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を水および炭酸水素ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒溜去した。得られた残渣を蒸留して、目的物40.8gを得た。沸点106-112℃(0.3 mmHg)。

(参考例3)

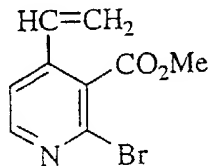
2-ブロモ-4-(1-ブロモエチル)ピリジン-3-カルボン酸メチルの合成(化合物No. 2a-3)



10 ベンゼン500mlに2-ブロモ-4-エチルピリジン-3-カルボン酸メチル44.1g(181mmol)、N-ブロモコハク酸イミド45.7g(254mmol)、酢酸5mlおよびアゾビスイソブチロニトリル0.3gを加え、還流下、2時間光照射(500Wタングステンランプ)した。室温まで冷却後、不溶物を濾別し、得られたベンゼン溶液を水、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒溜去して、目的物57.5gを得た。油状物質。

(参考例4)

2-ブロモ-4-ビニルピリジン-3-カルボン酸メチルの合成(化合物No. 2a-7)

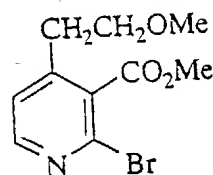
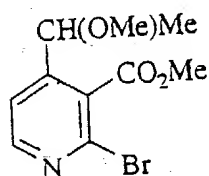


20 トルエン100mlに2-ブロモ-4-(1-ブロモエチル)ピリジン-3-カルボン酸メチル9.12g(28.2mmol)と1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン4.30g(28.2mmol)を加え、9-10℃にて3.5時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却後、酢酸エチル200

mlを加え、得られた溶液を水洗した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒溜去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：クロロホルム）にて精製し、目的物 2.13 g を得た。油状物質。

（参考例 5）

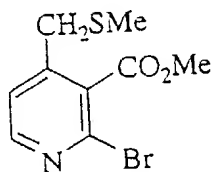
- 5 2-ブロモ-4-(1-メトキシエチル)ピリジン-3-カルボン酸メチル（化合物 No. 2a-10）および 2-ブロモ-4-(2-メトキシエチル)ピリジン-3-カルボン酸メチル（化合物 No. 2a-11）の合成



- 10 メタノール 50 ml に 2-ブロモ-4-(1-ブロモエチル)ピリジン-3-カルボン酸メチル 4.60 g (14.2 mmol) と 28% ナトリウムメトキシドメタノール溶液 3.41 g (17.7 mmol) を加え、70℃にて 8 時間攪拌した。メタノールを溜去後、残渣に酢酸エチルを加え、水洗した。得られた酢酸エチル溶液を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒溜去した。得られた残渣を高速液体クロマトグラフィー（ODS カラム、移動相：アセトニトリル/水 = 7/3）にて分離精製して、2-ブロモ-4-(1-メトキシエチル)ピリジン-3-カルボン酸メチル 1.64 g と 2-ブロモ-4-(2-メトキシエチル)ピリジン-3-カルボン酸メチル 0.90 g を得た。各々、油状物質。

（参考例 6）

- 2-ブロモ-4-メチルチオメチルピリジン-3-カルボン酸メチル（化合物 No. 2a-13）の合成

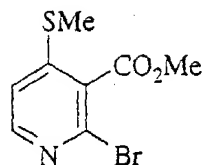


- 20 テトラヒドロフラン 15 ml に 2-ブロモ-4-ブロモメチルピリジン-3-カルボン酸メチル 1.54 g (4.98 mmol) とメチルメルカプタンナトリウム塩 0.40 g (5.70 mmol) を加え、10 分間還流した。室温まで冷却後、水 50 ml を加え、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸

エチル溶液を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒溜去して、目的物 1.40 g を得た。油状物質。

(参考例 7)

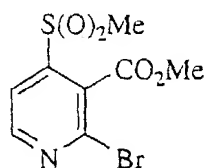
2-ブロモ-4-メチルチオピリジン-3-カルボン酸メチル (化合物 No. 2a-15) の合成



アセトニトリル 100 ml に 3-クロロ-2-シアノ-2-ブテン酸メチル 5.64 g (35.3 mmol) を溶解し、メチルメルカプタンナトリウム塩 2.47 g (35.3 mmol) を室温にて分割投入した。30 分間攪拌後、水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、溶媒溜去した。得られた残渣に N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 8.41 g (70.6 mmol) を加え、110℃にて 5 分間攪拌した。減圧下、過剰の N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタールを溜去した後、残渣を酢酸 50 ml に溶解させ、25% 臭化水素酸酢酸溶液 34.3 g (106 mmol) を加え、室温にて 12 時間攪拌した。反応混合物を水 200 ml に投入し、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を水、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: クロロホルム) にて精製し、目的物 3.64 g を得た。融点 68-72℃。

(参考例 8)

2-ブロモ-4-メチルスルホニルピリジン-3-カルボン酸メチル (化合物 No. 2a-20) の合成

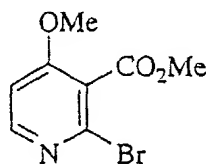


クロロホルム 20 ml に 2-ブロモ-4-メチルチオピリジン-3-カルボン

酸メチル 0.86 g (3.3 mmol) と α -クロロ過安息香酸 1.70 g (9.84 mmol) を加え、室温にて 3 時間攪拌した。クロロホルム 50 ml を加え、10% 亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄した。得られたクロロホルム溶液を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒溜去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：クロロホルム）にて精製し、目的物 0.93 g を得た。融点 15–118℃。

（参考例 9）

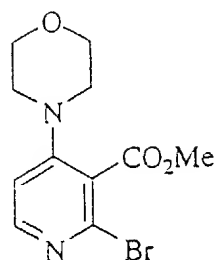
2-ブロモ-4-メトキシピリジン-3-カルボン酸メチル（化合物 No. 2 a-21）の合成



メタノール 100 ml に 2-シアノ-3-メトキシ-2-ブテン酸メチル 10.0 g (64.5 mmol) と N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 15.4 g (129 mmol) を加え、2.5 時間還流した。メタノールを溜去した後、酢酸 80 ml と 25% 臭化水素酸酢酸溶液 62.8 g (194 mmol) を加え、室温にて 18 時間、さらに 40℃ にて 9 時間攪拌した。反応混合物を氷水 300 ml に投入し、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を水、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：クロロホルム）にて精製し、さらに n-ヘキサン/ジイソプロピルエーテル = 1/2 の混合溶媒で洗浄、乾燥させて、目的物 2.77 g を得た。融点 92–96℃。

（参考例 10）

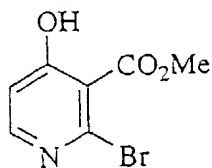
2-ブロモ-4-（モルホリン-4-イル）ピリジン-3-カルボン酸メチル（化合物 No. 2 a-23）の合成



- モルホリン 25 ml に 2-シアノ-3-エトキシ-2-ブテン酸メチル 5.0 g (29.6 mmol) を加え、120℃にて、生成してくるエタノールを溜去しながら 2 時間加熱撹拌した。減圧下、過剰のモルホリンを溜去後、残渣に N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 7.10 g (59.2 mmol) を加え、110℃にて 1.5 時間加熱撹拌した。減圧下、過剰の N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタールを溜去後、残渣に酢酸 30 ml と 25% 臭化水素酸酢酸溶液 28.7 g (89.0 mmol) を加え、室温にて 4 日間撹拌した。反応混合物を水 300 ml に投入し、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を水、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：クロロホルム）にて精製し、目的物 1.19 g を得た。油状物質。

(参考例 11)

- 2-ブロモ-4-ヒドロキシピリジン-3-カルボン酸メチル（化合物 No. 2a-26）の合成



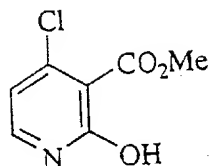
- 塩化メチレン 60 ml に 2-ブロモ-4-メトキシピリジン-3-カルボン酸メチル 1.0 g (5.8 mmol) と 10% エチルメルカプタン塩化メチレン溶液 3 ml を加え、0℃にて塩化アルミニウム 3.9 g (29 mmol) を分割投入した。0℃にて 1 時間撹拌後、反応混合物を水 100 ml に投入し、クロロホルム 50 ml を加え、有機層を分離した。有機層を塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒溜去した。得られた残渣をジイソ

プロピルエーテルで洗浄後、乾燥させて、目的物 0.66 g を得た。融点 144-145℃。

(参考例 12)

2-ヒドロキシ-4-クロロピリジン-3-カルボン酸メチル (化合物 No.

5 4a-27) 合成



ベンゼン 50 ml に 4-クロロニコチン酸 3.69 g (23.4 mmol) と塩化チオニル 25 ml を加え、4.5 時間還流した。ベンゼンおよび過剰の塩化チオニルを溜去した残渣をテトラヒドロフラン 80 ml に溶解し、メタノール 10 ml とトリエチルアミン 10 ml を加えて、室温にて 1 時間攪拌した。反応混合物を水 100 ml に投入し、酢酸エチルにて抽出操作をおこなった。得られた酢酸エチル溶液を塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥、溶媒溜去した。残渣をクロロホルム 50 ml に溶解し、m-クロロ過安息香酸 6.76 g (39.2 mmol) を加え、40℃にて 1.5 時間攪拌した。クロロホルム 100 ml を追加した後、10%亜硫酸水素ナトリウム飽和水溶液、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄した。得られたクロロホルム溶液を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒溜去して 4-クロロニコチン酸メチル-1-オキシド 2.90 g を得た。融点 100-103℃。

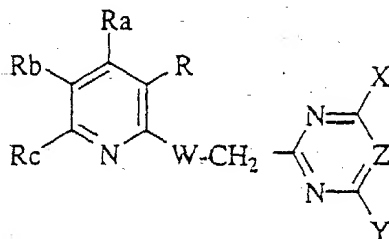
氷冷下、オキシ塩化リン 40 g に 4-クロロニコチン酸メチル-1-オキシド 3.60 g (19.2 mmol) を加え、トリエチルアミン 13.6 g (134 mmol) を 0.5 時間かけて滴下し、そのまま 1 時間攪拌した。減圧下、オキシ塩化リンを溜去後、水 50 ml を加えて、1 時間攪拌した。クロロホルムにて抽出操作をおこない、得られたクロロホルム溶液を塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/n-ヘキサン = 2/1) にて精製し、目的物 1.17 g を得た。融点 145-150℃。

前記実施例および参考例と同様の方法を用いることにより合成された化合物の構造式と物性値を、前記実施例および参考例の化合物とともに第1表ないし第4表に示す。

但し、表中の記号は前記と同様の意味を表す。

5

第1表



	No.	R	R a	R b	R c	W	X	Y	Z	物性値 (融点、℃)
10	1a-1	CO ₂ Me	Ph	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-2	CO ₂ H	Ph	H	H	O	OMe	OMe	CH	188-192
	1a-3	CO ₂ Me	Ph	H	H	S	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-4	CO ₂ H	Ph	H	H	S	OMe	OMe	CH	175-178
	1a-5	CO ₂ H	H	H	H	S	OMe	OMe	CH	194-198
15	1a-6	CO ₂ H	H	H	H	O	OMe	OMe	CH	164-165
	1a-7	CO ₂ Me	H	H	H	O	OMe	OMe	CH	107-109
	1a-8	CO ₂ Et	Et	H	H	S	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-9	CO ₂ H	Me	H	H	O	OMe	OMe	CH	135-138
	1a-10	CO ₂ H	Et	H	H	O	OMe	OMe	CH	162-164
20	1a-11	CO ₂ Me	Et	H	H	O	OMe	OMe	CH	64-66
	1a-12	CO ₂ H	Pr-iso	H	H	O	OMe	OMe	CH	163-166
	1a-13	CO ₂ H	OMe	H	H	O	OMe	OMe	CH	150-155
	1a-14	CO ₂ Me	OMe	H	H	O	OMe	OMe	CH	85-87
	1a-15	CO ₂ Me	OE _t	H	H	O	OMe	OMe	CH	71-76
25	1a-16	CO ₂ H	OE _t	H	H	O	OMe	OMe	CH	150-155
	1a-17	CO ₂ Me	A5	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質

第1表 (続き)

	No.	R	R a	R b	R c	W	X	Y	Z	物性値 (融点、℃)
5	1a-18	CO ₂ Me	Q1	H	H	O	OMe	OMe	CH	76-78
	1a-19	CO ₂ H	Q1	H	H	O	OMe	OMe	CH	105-106
	1a-20	CO ₂ N ⁺ HEt ₃	Q1	H	H	O	OMe	OMe	CH	樹脂状物質
	1a-21	CO ₂ H	A5	H	H	O	OMe	OMe	CH	75-80
	1a-22	CO ₂ Me	A33	H	H	O	OMe	OMe	CH	115-117
10	1a-23	CO ₂ H	A33	H	H	O	OMe	OMe	CH	98-102
	1a-24	CO ₂ Me	Me	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-25	CO ₂ Me	NMe ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-26	CO ₂ H	SMe	H	H	O	OMe	OMe	CH	165-168
	1a-27	CO ₂ Me	SMe	H	H	O	OMe	OMe	CH	108-111
15	1a-28	CO ₂ Me	SO ₂ Me	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-29	CO ₂ CH ₂ OEt	Me	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-30	CO ₂ H	NMe ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH	樹脂状物質
	1a-31	CO ₂ H	SO ₂ Me	H	H	O	OMe	OMe	CH	樹脂状物質
	1a-32	CO ₂ CH ₂ OEt	OMe	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
20	1a-33	CO ₂ H	Q3	H	H	O	OMe	OMe	CH	101-106
	1a-34	CO ₂ Me	Q3	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-35	CO ₂ Me	Q8	H	H	O	OMe	OMe	CH	116-120
	1a-36	CO ₂ H	Q8	H	H	O	OMe	OMe	CH	173-175
	1a-37	CO ₂ H	Pr-cyc	H	H	O	OMe	OMe	CH	183-184
25	1a-38	CO ₂ Me	Pr-cyc	H	H	O	OMe	OMe	CH	54-55
	1a-39	CO ₂ Me	Pr-n	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-40	CO ₂ H	OPh	H	H	O	OMe	OMe	CH	159-163
	1a-41	CO ₂ Me	OPh	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-42	CO ₂ H	Pr-n	H	H	O	OMe	OMe	CH	144-145

第1表 (続き)

	No.	R	R a	R b	R c	W	X	Y	Z	物性値 (融点、℃)
5	1a-43	CO ₂ H	Q2	H	H	O	OMe	OMe	CH	166-168
	1a-44	CO ₂ Me	Q2	H	H	O	OMe	OMe	CH	93-94
	1a-45	CO ₂ H	Q60	H	H	O	OMe	OMe	CH	166-168
	1a-46	CO ₂ Me	Q60	H	H	O	OMe	OMe	CH	96-97
	1a-47	CO ₂ Me	SPh	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
10	1a-48	CO ₂ H	SPh	H	H	O	OMe	OMe	CH	201-204
	1a-49	CO ₂ H	SO ₂ Ph	H	H	O	OMe	OMe	CH	185-187
	1a-50	CO ₂ H	Q74	H	H	O	OMe	OMe	CH	139-143
	1a-51	CO ₂ Me	Q74	H	H	O	OMe	OMe	CH	84-85
	1a-52	CO ₂ H	Q84	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
15	1a-53	CO ₂ Me	Q84	H	H	O	OMe	OMe	CH	119-121
	1a-54	CO ₂ Me	Q87	H	H	O	OMe	OMe	CH	92-93
	1a-55	CO ₂ H	Q87	H	H	O	OMe	OMe	CH	78-83
	1a-56	CO-Q16	Me	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-57	CO ₂ Me	CHMe(OMe)	H	H	O	OMe	OMe	CH	108-110
20	1a-58	CO ₂ Me	SEt	H	H	O	OMe	OMe	CH	89-91
	1a-59	CO ₂ H	CHMe(OMe)	H	H	O	OMe	OMe	CH	128-130
	1a-60	CO ₂ H	SEt	H	H	O	OMe	OMe	CH	157-160
	1a-61	CO ₂ H	Q72	H	H	O	OMe	OMe	CH	133-134
	1a-62	CO ₂ Me	Q72	H	H	O	OMe	OMe	CH	107-108
25	1a-63	CO ₂ Me	CO ₂ Et	H	H	O	OMe	OMe	CH	油状物質
	1a-64	CO ₂ H	CO ₂ H	H	H	O	OMe	OMe	CH	191-192
	1a-65	CO ₂ H	Q80	H	H	O	OMe	OMe	CH	158-160
	1a-66	CO ₂ Me	Q80	H	H	O	OMe	OMe	CH	100-102
	1a-67	CO ₂ Me	CHMe(SMe)	H	H	O	OMe	OMe	CH	83-84

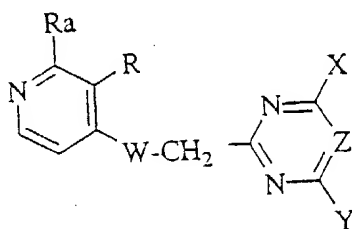
第1表 (続き)

No.	R	R a	R b	R c	W	X	Y	Z	物性値 (融点、℃)
5	1a-68	CO ₂ H	CHMe(SMe)	H	H	O	OMe	OMe	CH 114-115
	1a-69	CO ₂ Me	Q61	H	H	O	OMe	OMe	CH 137-138
	1a-70	CO ₂ H	Q61	H	H	O	OMe	OMe	CH 200
	1a-71	CO ₂ Me	CH=CH ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH 油状物質
	1a-72	CO ₂ H	CH=CH ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH 127-128
10	1a-73	CO ₂ H	PhCH ₂ O	H	H	O	OMe	OMe	CH 178-182
	1a-74	CO ₂ Me	PhCH ₂ O	H	H	O	OMe	OMe	CH 99-100
	1a-75	CO ₂ Me	OH	H	H	O	OMe	OMe	CH 114-115
	1a-76	CO ₂ H	OH	H	H	O	OMe	OMe	CH 186-191
	1a-77	CO ₂ H	MeS(O)	H	H	O	OMe	OMe	CH 178-188
15	1a-78	CO ₂ H	MeOCH ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH 124-125
	1a-79	CO ₂ Me	MeOCH ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH 油状物質
	1a-80	CO ₂ Me	MeSCH ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH 油状物質
	1a-81	CO ₂ H	MeSCH ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH 127-128
	1a-82	CO ₂ H	CMe=CH ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH 148-150
20	1a-83	CO ₂ Me	CMe=CH ₂	H	H	O	OMe	OMe	CH 75-76
	1a-84	CO ₂ H	CH=CHMe	H	H	O	OMe	OMe	CH 138-141
	1a-85	CO ₂ Me	CH=CHMe	H	H	O	OMe	OMe	CH 77-78
	1a-86	CO ₂ Me	Cl	H	H	O	OMe	OMe	CH 油状物質
	1a-87	CO ₂ H	Cl	H	H	O	OMe	OMe	CH 138-142
25	1a-88	CO ₂ Me	CF ₃	H	H	O	OMe	OMe	CH 55-58
	1a-89	CO ₂ H	CF ₃	H	H	O	OMe	OMe	CH 115-117
	1a-90	CN	Me	H	Me	O	OMe	OMe	CH 120-123
	1a-91	CO ₂ Me	COMe	H	H	O	OMe	OMe	CH 油状物質
	1a-92	CO ₂ H	H	H	H	S	OMe	OMe	N 215-216

第1表 (続き)

No.	R	R a	R b	R c	W	X	Y	Z	物性値 (融点、℃)
5	1a-93	CO ₂ Na	Q1	H	H	O	OMe	OMe	CH 樹脂状物質
	1a-94	CO ₂ K	Q1	H	H	O	OMe	OMe	CH 239-241
	1a-95	CO ₂ Me	SH	H	H	O	OMe	OMe	CH 油状物質
	1a-96	CO ₂ CH ₂ Ph	CO ₂ CH ₂ Ph	H	H	O	OMe	OMe	CH 油状物質
	1a-97	CO ₂ H	Me	H	Me	O	OMe	OMe	CH 177-179
10	1a-98	CO ₂ Et	Me	H	Me	O	OMe	OMe	CH 油状物質
	1a-99	CO ₂ H	CMe=NOMe	H	H	O	OMe	OMe	CH 119-120
	1a-100	CO ₂ Me	CMe=NOMe	H	H	O	OMe	OMe	CH 93-94 -
	1a-101	CO ₂ H	CO ₂ Me	H	H	O	OMe	OMe	CH 148-151
	1a-102	CO ₂ Me	CO ₂ Me	H	H	O	OMe	OMe	CH 99-104
15	1a-103	CO ₂ H	CN	H	H	O	OMe	OMe	CH 212-215
	1a-104	CO ₂ Me	CN	H	H	O	OMe	OMe	CH 129-133
	1a-105	CO ₂ Me	CHO	H	H	O	OMe	OMe	CH 油状物質

第2表



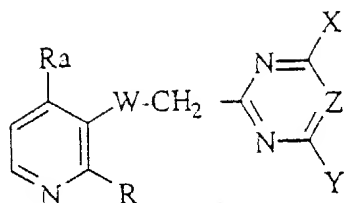
20

25

No.	R	R a	W	X	Y	Z	物性値 (融点、℃)
25	1b-1	CO ₂ Me	H	O	OMe	OMe	CH 74-76
	1b-2	CO ₂ H	H	O	OMe	OMe	CH 187-190
	1b-3	CO ₂ Me	Br	O	OMe	OMe	CH 102-104

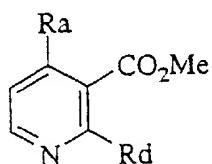
61

第3表



No.	R	Ra	W	X	Y	Z	物性値 (融点、℃)
5	1c-1	CO ₂ H	H	0	OMe	OMe	CH 94-99
	1c-2	CO ₂ Me	H	0	OMe	OMe	CH 68-70

第4表



10

No.	Ra	Rd	物性値 (融点、℃)
15	2a-1	Me	Cl 油状物質
	2a-2	Et	Br 油状物質
	2a-3	CHBrMe	Br 油状物質
	2a-4	CH ₂ Br	Br 油状物質
	2a-5	CHBrEt	Br 油状物質
	2a-6	CBrMe ₂	Br 油状物質
20	2a-7	CH=CH ₂	Br 油状物質
	2a-8	CH=CHMe	Br 油状物質

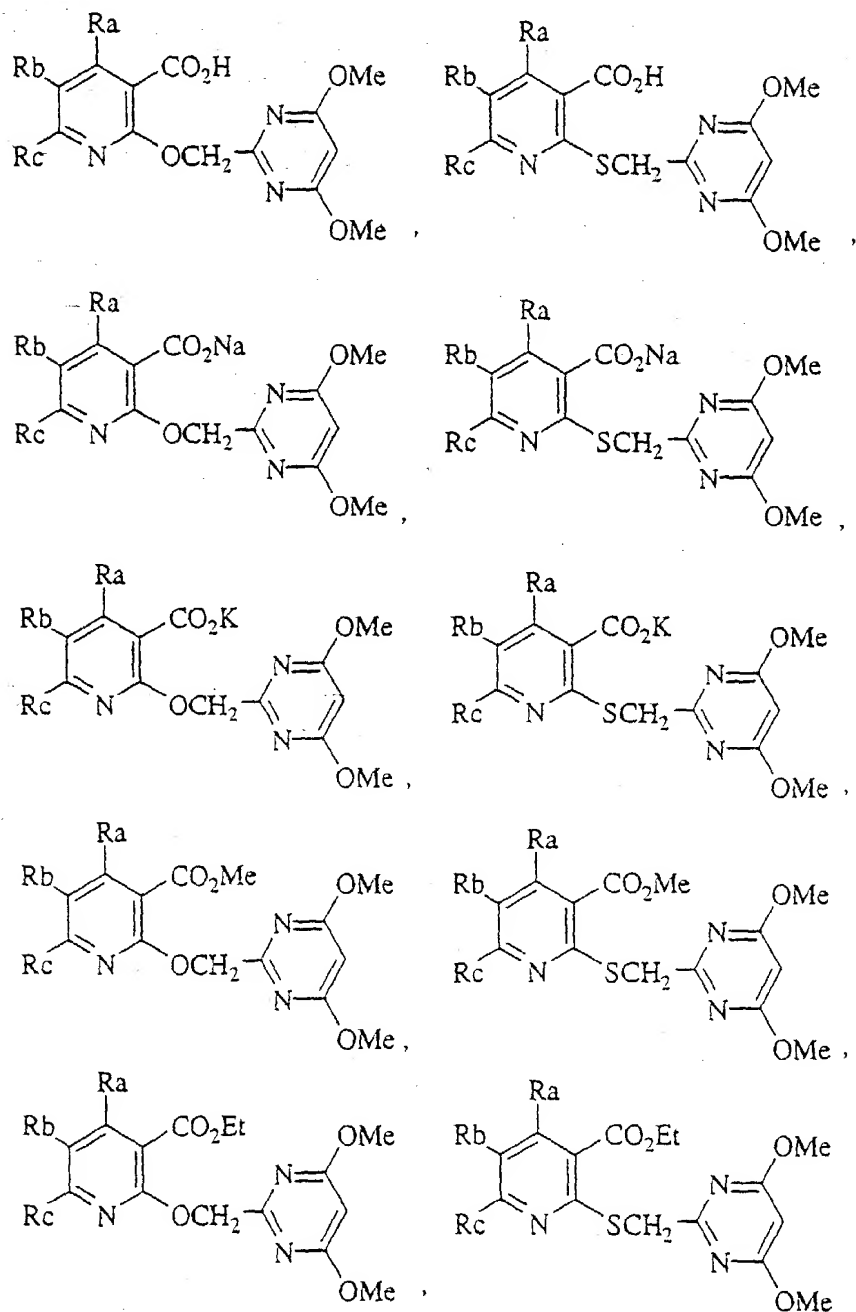
第4表 (続き)

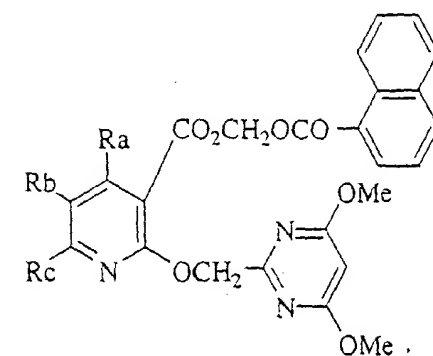
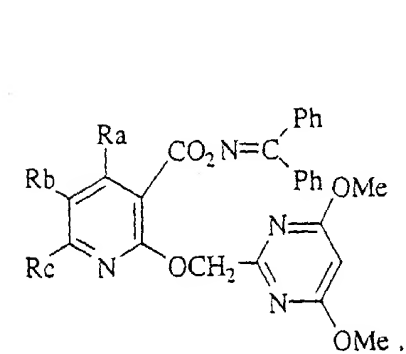
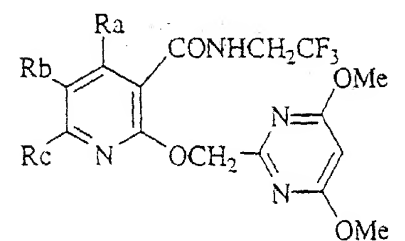
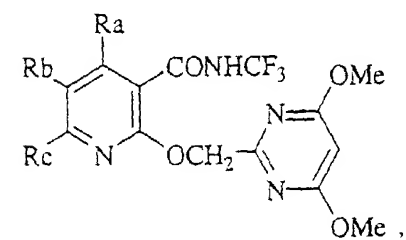
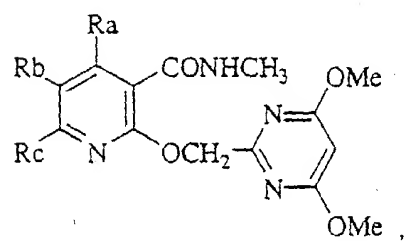
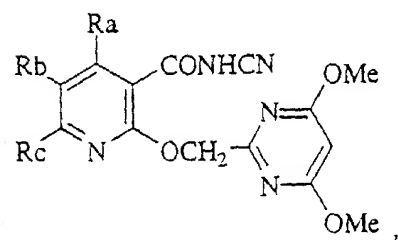
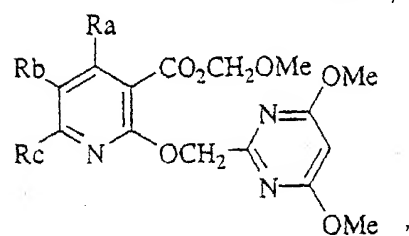
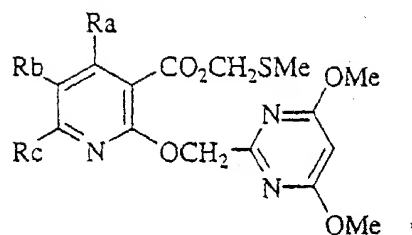
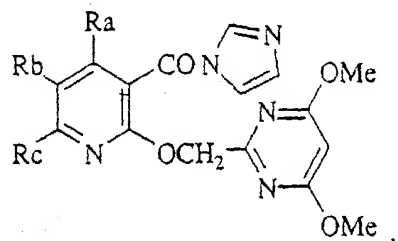
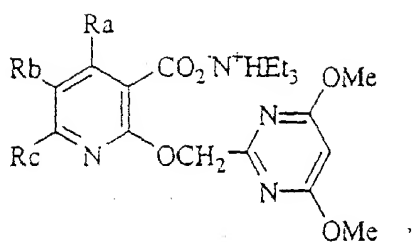
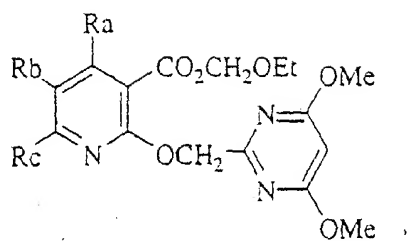
N o .	R a	R d	物性値 (融点、℃)
5	2a-9	CMe=CH ₂	油状物質
	2a-10	CH(OMe)Me	油状物質
	2a-11	CH ₂ CH ₂ OMe	油状物質
	2a-12	CH ₂ OMe	油状物質
	2a-13	CH ₂ SMe	油状物質
10	2a-14	CH(SMe)Me	油状物質
	2a-15	SMe	68-72
	2a-16	SEt	41-44
	2a-17	SCH ₂ CF ₃	油状物質
	2a-18	SPh	油状物質
15	2a-19	OPh	120-122
	2a-20	SO ₂ Me	115-118
	2a-21	OMe	92-96
	2a-22	OEt	66-68
	2a-23	A33	油状物質
20	2a-24	A5	油状物質
	2a-25	NMe ₂	油状物質
	2a-26	OH	144-145
	4a-27	Cl	145-150
	4a-28	CF ₃	161-166
25	4a-29	CH=CH ₂	OH
	4a-30	SMe	OH
	4a-31	OMe	OH
	2a-32	CN	Br

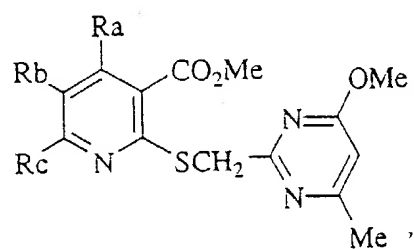
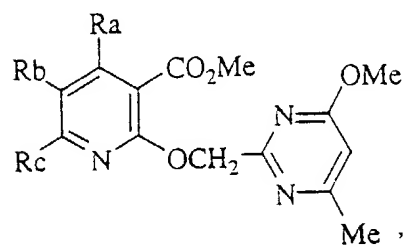
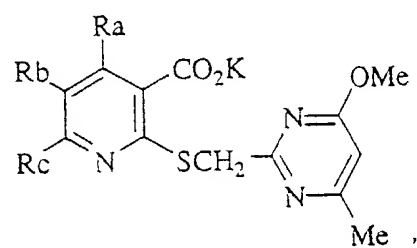
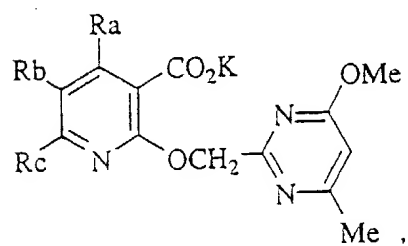
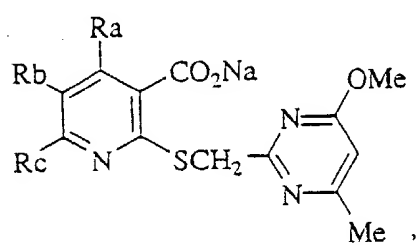
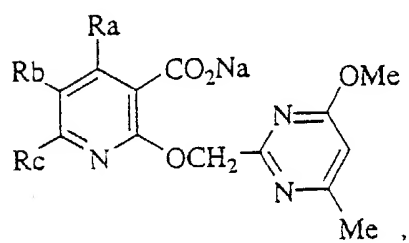
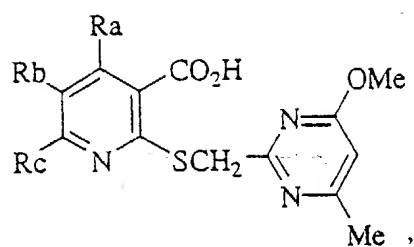
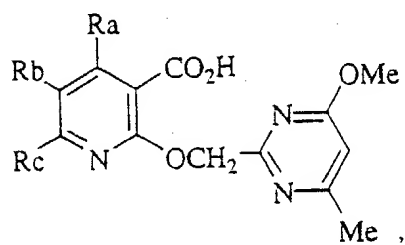
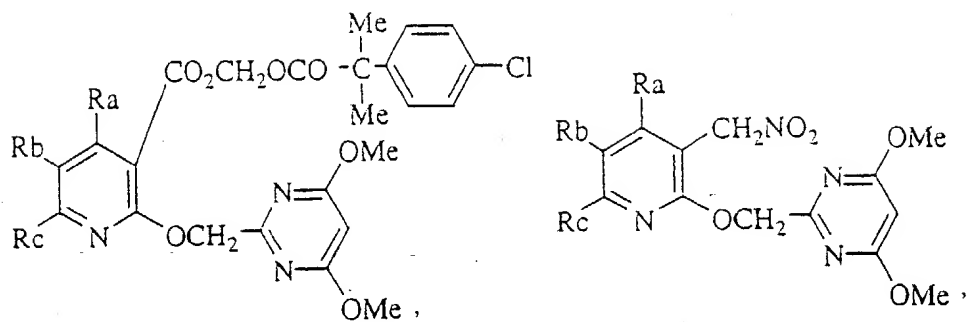
次に、本発明に含まれる化合物の例を、前記実施例で合成した化合物を含め第5表および第6表に示すが、本発明化合物はこれらに限定されるものではない。但し、表中の記号は前記と同様の意味を表す。

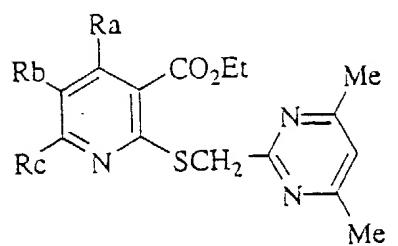
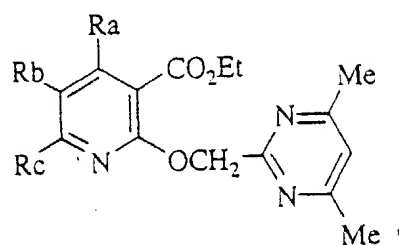
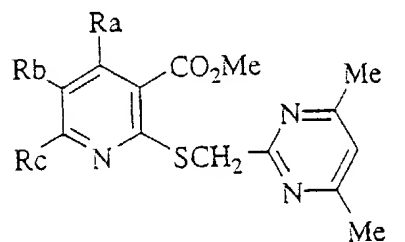
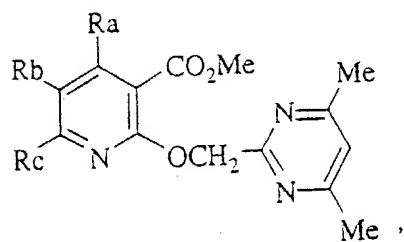
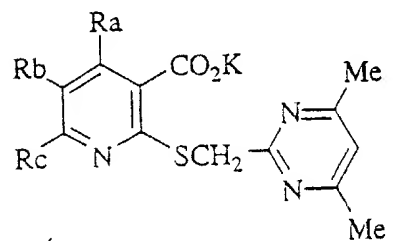
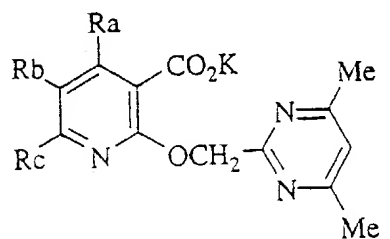
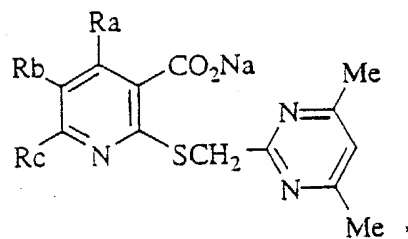
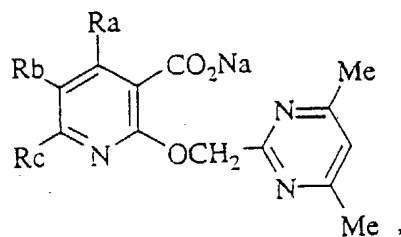
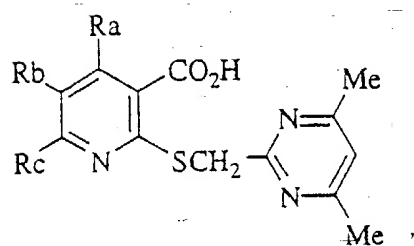
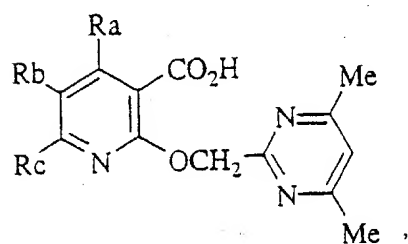
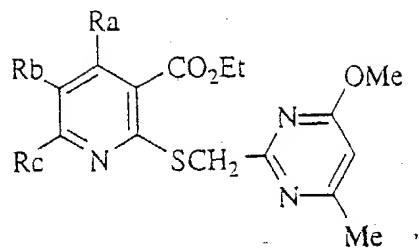
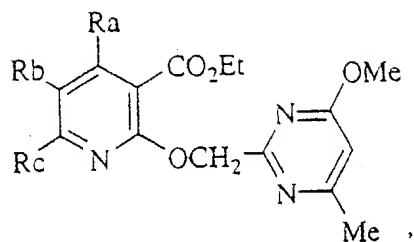
第5表

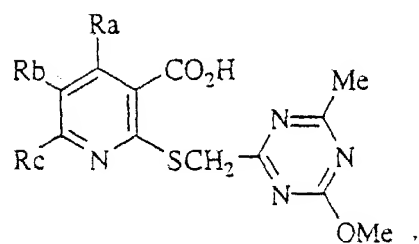
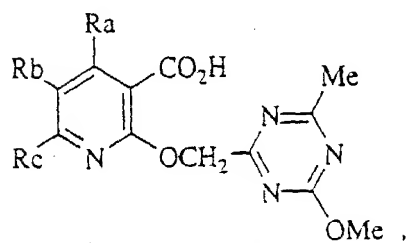
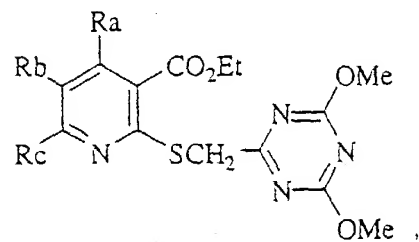
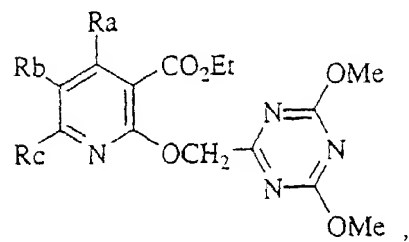
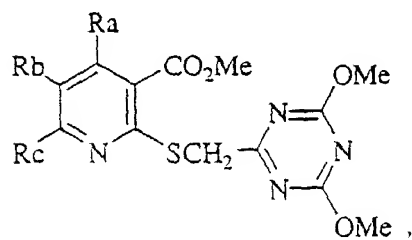
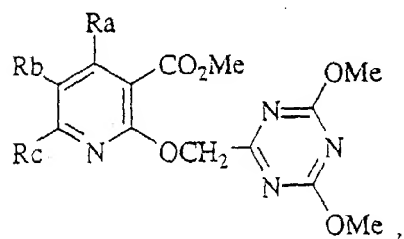
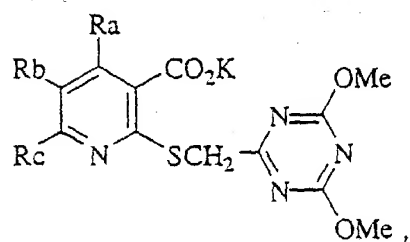
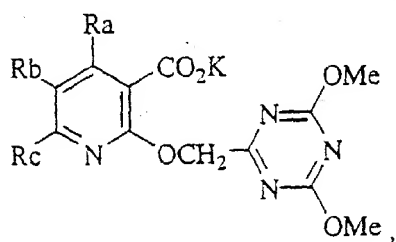
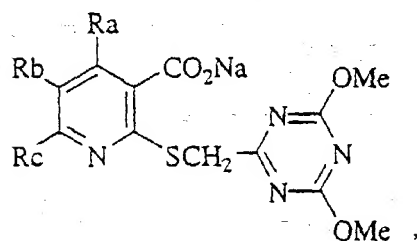
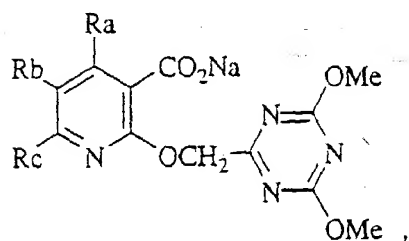
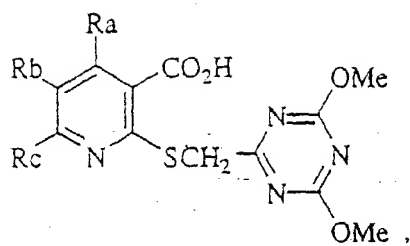
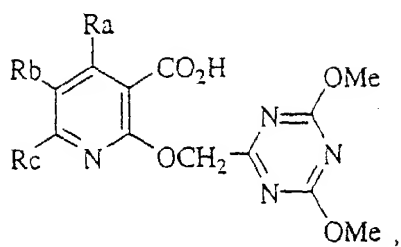
5

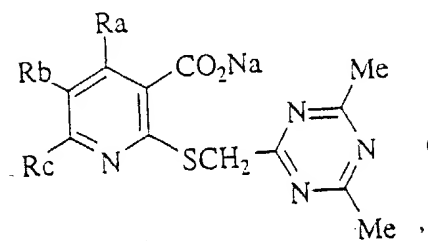
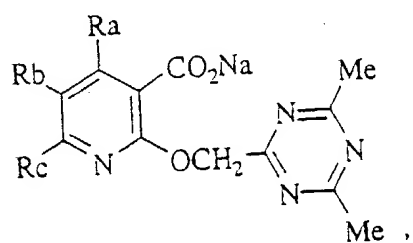
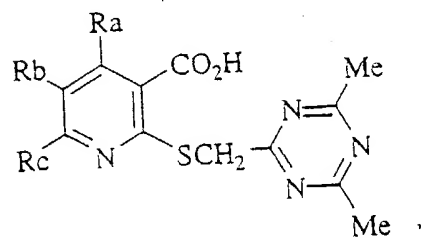
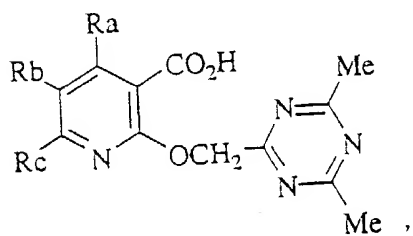
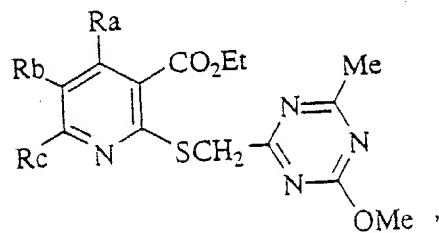
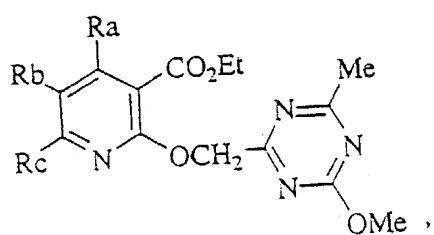
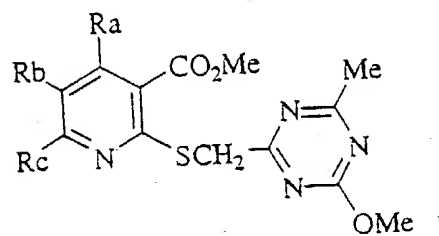
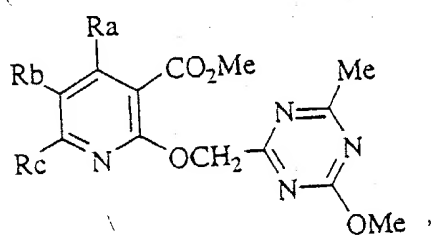
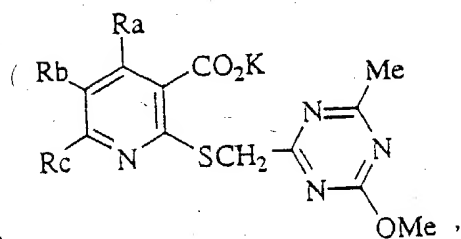
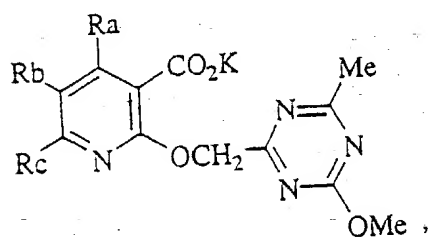
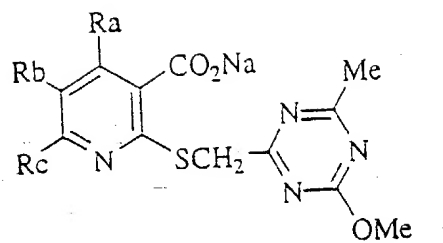
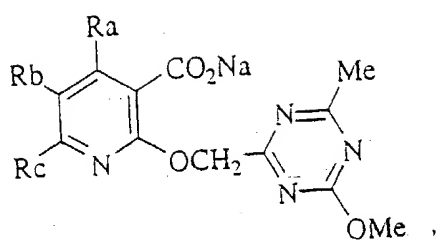


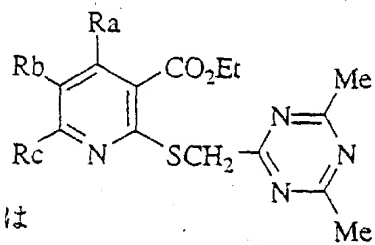
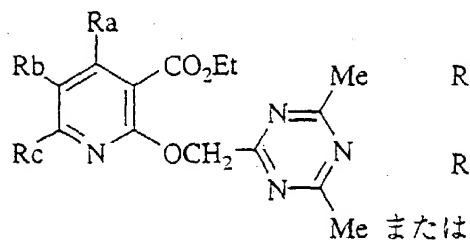
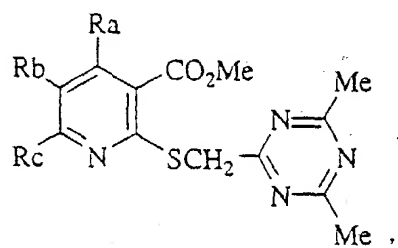
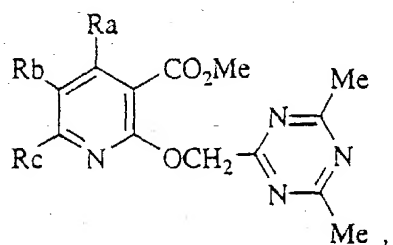
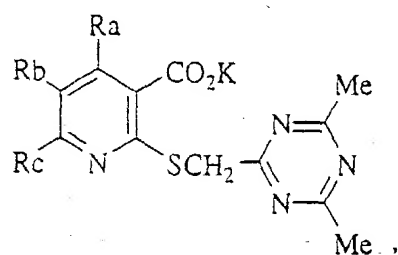
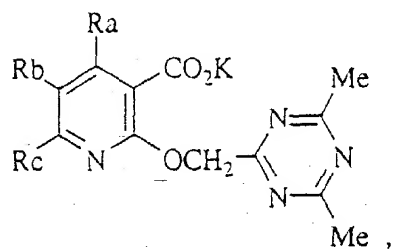












または

R a	R b	R c	R a	R b	R c
H	H	H	Bu-ter	H	H
F	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
Cl	H	H	CH ₂ CH=CHMe	H	H
Br	H	H	CH ₂ CMe=CH ₂	H	H
I	H	H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	H
CN	H	H	CH ₂ C≡CH	H	H
NO ₂	H	H	CH ₂ C≡CMe	H	H
OH	H	H	OMe	H	H
Me	H	H	OEt	H	H
Et	H	H	OPr-n	H	H
Pr-n	H	H	OPr-iso	H	H
Pr-iso	H	H	OBu-n	H	H
Bu-n	H	H	OBu-iso	H	H
Bu-iso	H	H	OBu-sec	H	H
Bu-sec	H	H	OBu-ter	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	CO ₂ Et	H	H
OCH ₂ C≡CH	H	H	CO ₂ Pr-n	H	H
PhCH ₂ O	H	H	CO ₂ Pr-iso	H	H
SMe	H	H	CO ₂ Bu-n	H	H
SEt	H	H	CO ₂ Bu-iso	H	H
SPr-n	H	H	CO ₂ Bu-sec	H	H
SPr-iso	H	H	CO ₂ Bu-ter	H	H
SBu-n	H	H	CO ₂ H	H	H
SBu-iso	H	H	MeCOO	H	H
SBu-sec	H	H	EtCOO	H	H
SBu-ter	H	H	(Pr-n)COO	H	H
SOMe	H	H	(Pr-iso)COO	H	H
SOEt	H	H	(Bu-n)COO	H	H
SOPr-n	H	H	(Bu-iso)COO	H	H
SOPr-iso	H	H	(Bu-sec)COO	H	H
SOBu-n	H	H	(Bu-ter)COO	H	H
SOBu-iso	H	H	(Pen-n)COO	H	H
SOBu-sec	H	H	HOCH ₂	H	H
SOBu-ter	H	H	HOCH ₂ CH ₂	H	H
S(O) ₂ Me	H	H	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H
S(O) ₂ Et	H	H	MeCH(OH)	H	H
S(O) ₂ Pr-n	H	H	MeCH(OH)CH ₂	H	H
S(O) ₂ Pr-iso	H	H	MeCH(OH)CH ₂ CH ₂	H	H
S(O) ₂ Bu-n	H	H	EtCH(OH)CH ₂	H	H
S(O) ₂ Bu-iso	H	H	CH ₂ F	H	H
S(O) ₂ Bu-sec	H	H	CH ₂ Cl	H	H
S(O) ₂ Bu-ter	H	H	CH ₂ Br	H	H
CHO	H	H	CH ₂ I	H	H
MeCO	H	H	CHF ₂	H	H
EtCO	H	H	CHCl ₂	H	H
(Pr-n)CO	H	H	CHBr ₂	H	H
(Pr-iso)CO	H	H	CF ₃	H	H
(Bu-n)CO	H	H	CCl ₃	H	H
(Bu-iso)CO	H	H	CBr ₃	H	H
(Bu-sec)CO	H	H	CClF ₂	H	H
(Bu-ter)CO	H	H	CBrF ₂	H	H
(Pen-n)CO	H	H	CH ₂ FCH ₂	H	H
CO ₂ Me	H	H	CHF ₂ CH ₂	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
CF ₃ CH ₂	H	H	2-Cl-PhO	H	H
CF ₃ CF ₂	H	H	3-Cl-PhO	H	H
CF ₃ CF ₂ CF ₂	H	H	4-Cl-PhO	H	H
ClCH ₂ CH ₂	H	H	2-F-PhO	H	H
BrCH ₂ CH ₂	H	H	3-F-PhO	H	H
CCl ₃ CH ₂	H	H	4-F-PhO	H	H
CF ₃ CH ₂ CH ₂	H	H	2-Br-PhO	H	H
CCl ₃ CH ₂ CH ₂	H	H	3-Br-PhO	H	H
ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	4-Br-PhO	H	H
FCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	2-Me-PhO	H	H
CF ₃ CF ₂ CH ₂	H	H	3-Me-PhO	H	H
ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	4-Me-PhO	H	H
Ph	H	H	2-MeO-PhO	H	H
2-Cl-Ph	H	H	3-MeO-PhO	H	H
3-Cl-Ph	H	H	4-MeO-PhO	H	H
4-Cl-Ph	H	H	2-CF ₃ -PhO	H	H
2-F-Ph	H	H	3-CF ₃ -PhO	H	H
3-F-Ph	H	H	4-CF ₃ -PhO	H	H
4-F-Ph	H	H	2-NO ₂ -PhO	H	H
2-Br-Ph	H	H	3-NO ₂ -PhO	H	H
3-Br-Ph	H	H	4-NO ₂ -PhO	H	H
4-Br-Ph	H	H	2-CN-PhO	H	H
2-Me-Ph	H	H	3-CN-PhO	H	H
3-Me-Ph	H	H	4-CN-PhO	H	H
4-Me-Ph	H	H	NH ₂	H	H
2-MeO-Ph	H	H	NHMe	H	H
3-MeO-Ph	H	H	NMe ₂	H	H
4-MeO-Ph	H	H	NHEt	H	H
2-CF ₃ -Ph	H	H	NEt ₂	H	H
3-CF ₃ -Ph	H	H	NH(Pr-n)	H	H
4-CF ₃ -Ph	H	H	N(Pr-n) ₂	H	H
2-NO ₂ -Ph	H	H	NH(Pr-iso)	H	H
3-NO ₂ -Ph	H	H	N(Pr-iso) ₂	H	H
4-NO ₂ -Ph	H	H	NHCH ₂ CH=CH ₂	H	H
2-CN-Ph	H	H	NHCH ₂ CH=CHMe	H	H
3-CN-Ph	H	H	NHCH ₂ CMe=CH ₂	H	H
4-CN-Ph	H	H	NHCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	H
PhO	H	H	NHCH ₂ C≡CH	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
NHCH ₂ C≡CMe	H	H	A 2 8	H	H
NHOMe	H	H	A 2 9	H	H
NHOEt	H	H	A 3 0	H	H
NHOPr-n	H	H	A 3 1	H	H
NHOPr-iso	H	H	A 3 2	H	H
NMeOMe	H	H	A 3 3	H	H
NMeOEt	H	H	A 3 4	H	H
NHPh	H	H	A 3 5	H	H
NMePh	H	H	A 3 6	H	H
NHCH ₂ Ph	H	H	A 3 7	H	H
NMeCH ₂ Ph	H	H	CH=NOMe	H	H
A 1	H	H	CH=NOEt	H	H
A 2	H	H	CH=NOPr-n	H	H
A 3	H	H	CH=NOPr-iso	H	H
A 4	H	H	CH=NOBu-n	H	H
A 5	H	H	CH=NOBu-iso	H	H
A 6	H	H	CH=NOBu-sec	H	H
A 7	H	H	CH=NOBu-ter	H	H
A 8	H	H	CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	H	H
A 9	H	H	CH=NOCH ₂ CH=CHMe	H	H
A 1 0	H	H	CH=NOCH ₂ CMe=CH ₂	H	H
A 1 1	H	H	CH=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	H
A 1 2	H	H	CH=NOCH ₂ C≡CH	H	H
A 1 3	H	H	CH=NOCH ₂ C≡CMe	H	H
A 1 4	H	H	ClCH ₂ CH ₂ ON=CH	H	H
A 1 5	H	H	BrCH ₂ CH ₂ ON=CH	H	H
A 1 6	H	H	CCl ₃ CH ₂ ON=CH	H	H
A 1 7	H	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	H
A 1 8	H	H	CCl ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	H
A 1 9	H	H	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	H
A 2 0	H	H	FCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	H
A 2 1	H	H	CF ₃ CF ₂ CH ₂ ON=CH	H	H
A 2 2	H	H	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	H
A 2 3	H	H	CH=NOPr-cyc	H	H
A 2 4	H	H	CH=NOBu-cyc	H	H
A 2 5	H	H	CH=NOPen-cyc	H	H
A 2 6	H	H	CH=NOHex-cyc	H	H
A 2 7	H	H	CMe=NOMe	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
CMe=NOEt	H	H	CEt=NOCH ₂ C≡CH	H	H
CMe=NOPr-n	H	H	CEt=NOCH ₂ C≡CMe	H	H
CMe=NOPr-iso	H	H	ClCH ₂ CH ₂ ON=CEt	H	H
CMe=NOBu-n	H	H	BrCH ₂ CH ₂ ON=CEt	H	H
CMe=NOBu-iso	H	H	C(Pr-n)=NOMe	H	H
CMe=NOBu-sec	H	H	C(Pr-n)=NOEt	H	H
CMe=NOBu-ter	H	H	(MeO) ₂ CH	H	H
CMe=NOCH ₂ CH=CH ₂	H	H	(EtO) ₂ CH	H	H
CMe=NOCH ₂ CH=CHMe	H	H	((Pr-n)O) ₂ CH	H	H
CMe=NOCH ₂ CMe=CH ₂	H	H	((Pr-iso)O) ₂ CH	H	H
CMe=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	H	((Bu-n)O) ₂ CH	H	H
CMe=NOCH ₂ C≡CH	H	H	(MeO) ₂ CMe	H	H
CMe=NOCH ₂ C≡CMe	H	H	(EtO) ₂ CMe	H	H
ClCH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	H	((Pr-n)O) ₂ CMe	H	H
BrCH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	H	((Pr-iso)O) ₂ CMe	H	H
CCl ₃ CH ₂ ON=CMe	H	H	((Bu-n)O) ₂ CMe	H	H
CF ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	H	(MeS) ₂ CH	H	H
CCl ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	H	(EtS) ₂ CH	H	H
ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	H	((Pr-n)S) ₂ CH	H	H
FCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	H	((Pr-iso)S) ₂ CH	H	H
CF ₃ CF ₂ CH ₂ ON=CMe	H	H	((Bu-n)S) ₂ CH	H	H
ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	H	(MeS) ₂ CMe	H	H
CMe=NOPr-cyc	H	H	(EtS) ₂ CMe	H	H
CMe=NOBu-cyc	H	H	((Pr-n)S) ₂ CMe	H	H
CMe=NOPen-cyc	H	H	((Pr-iso)S) ₂ CMe	H	H
CMe=NOHex-cyc	H	H	((Bu-n)S) ₂ CMe	H	H
CEt=NOMe	H	H	B 1	H	H
CEt=NOEt	H	H	B 2	H	H
CEt=NOPr-n	H	H	B 3	H	H
CEt=NOPr-iso	H	H	B 4	H	H
CEt=NOBu-n	H	H	B 5	H	H
CEt=NOBu-iso	H	H	B 6	H	H
CEt=NOBu-sec	H	H	B 7	H	H
CEt=NOBu-ter	H	H	B 8	H	H
CEt=NOCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	Me	H
CEt=NOCH ₂ CH=CHMe	H	H	F	Me	H
CEt=NOCH ₂ CMe=CH ₂	H	H	Cl	Me	H
CEt=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	H	Br	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
I	Me	H	SOEt	Me	H
CN	Me	H	SOPr-n	Me	H
NO ₂	Me	H	SOPr-iso	Me	H
OH	Me	H	SOBu-n	Me	H
Me	Me	H	SOBu-iso	Me	H
Et	Me	H	SOBu-sec	Me	H
Pr-n	Me	H	SOBu-ter	Me	H
Pr-iso	Me	H	S(O) ₂ Me	Me	H
Bu-n	Me	H	S(O) ₂ Et	Me	H
Bu-iso	Me	H	S(O) ₂ Pr-n	Me	H
Bu-sec	Me	H	S(O) ₂ Pr-iso	Me	H
Bu-ter	Me	H	S(O) ₂ Bu-n	Me	H
CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	S(O) ₂ Bu-iso	Me	H
CH ₂ CH=CHMe	Me	H	S(O) ₂ Bu-sec	Me	H
CH ₂ CMe=CH ₂	Me	H	S(O) ₂ Bu-ter	Me	H
CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	CHO	Me	H
CH ₂ C≡CH	Me	H	MeCO	Me	H
CH ₂ C≡CMe	Me	H	EtCO	Me	H
OMe	Me	H	(Pr-n)CO	Me	H
OEt	Me	H	(Pr-iso)CO	Me	H
OPr-n	Me	H	(Bu-n)CO	Me	H
OPr-iso	Me	H	(Bu-iso)CO	Me	H
OBu-n	Me	H	(Bu-sec)CO	Me	H
OBu-iso	Me	H	(Bu-ter)CO	Me	H
OBu-sec	Me	H	(Pen-n)CO	Me	H
OBu-ter	Me	H	CO ₂ Me	Me	H
OCH ₂ CH=CH ₂	Me	H	CO ₂ Et	Me	H
OCH ₂ C≡CH	Me	H	CO ₂ Pr-n	Me	H
PhCH ₂ O	Me	H	CO ₂ Pr-iso	Me	H
SMe	Me	H	CO ₂ Bu-n	Me	H
SEt	Me	H	CO ₂ Bu-iso	Me	H
SPr-n	Me	H	CO ₂ Bu-sec	Me	H
SPr-iso	Me	H	CO ₂ Bu-ter	Me	H
SBu-n	Me	H	CO ₂ H	Me	H
SBu-iso	Me	H	MeCOO	Me	H
SBu-sec	Me	H	EtCOO	Me	H
SBu-ter	Me	H	(Pr-n)COO	Me	H
SOMe	Me	H	(Pr-iso)COO	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
(Bu-n)COO	Me	H	Ph	Me	H
(Bu-iso)COO	Me	H	2-Cl-Ph	Me	H
(Bu-sec)COO	Me	H	3-Cl-Ph	Me	H
(Bu-ter)COO	Me	H	4-Cl-Ph	Me	H
(Pen-n)COO	Me	H	2-F-Ph	Me	H
HOCH ₂	Me	H	3-F-Ph	Me	H
HOCH ₂ CH ₂	Me	H	4-F-Ph	Me	H
HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	H	2-Br-Ph	Me	H
MeCH(OH)	Me	H	3-Br-Ph	Me	H
MeCH(OH)CH ₂	Me	H	4-Br-Ph	Me	H
MeCH(OH)CH ₂ CH ₂	Me	H	2-Me-Ph	Me	H
EtCH(OH)CH ₂	Me	H	3-Me-Ph	Me	H
CH ₂ F	Me	H	4-Me-Ph	Me	H
CH ₂ Cl	Me	H	2-MeO-Ph	Me	H
CH ₂ Br	Me	H	3-MeO-Ph	Me	H
CH ₂ I	Me	H	4-MeO-Ph	Me	H
CHF ₂	Me	H	2-CF ₃ -Ph	Me	H
CHCl ₂	Me	H	3-CF ₃ -Ph	Me	H
CHBr ₂	Me	H	4-CF ₃ -Ph	Me	H
CF ₃	Me	H	2-NO ₂ -Ph	Me	H
CCl ₃	Me	H	3-NO ₂ -Ph	Me	H
CBr ₃	Me	H	4-NO ₂ -Ph	Me	H
CClF ₂	Me	H	2-CN-Ph	Me	H
CBrF ₂	Me	H	3-CN-Ph	Me	H
CH ₂ FCH ₂	Me	H	4-CN-Ph	Me	H
CHF ₂ CH ₂	Me	H	PhO	Me	H
CF ₃ CH ₂	Me	H	2-Cl-PhO	Me	H
CF ₃ CF ₂	Me	H	3-Cl-PhO	Me	H
CF ₃ CF ₂ CF ₂	Me	H	4-Cl-PhO	Me	H
ClCH ₂ CH ₂	Me	H	2-F-PhO	Me	H
BrCH ₂ CH ₂	Me	H	3-F-PhO	Me	H
CCl ₃ CH ₂	Me	H	4-F-PhO	Me	H
CF ₃ CH ₂ CH ₂	Me	H	2-Br-PhO	Me	H
CCl ₃ CH ₂ CH ₂	Me	H	3-Br-PhO	Me	H
ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	H	4-Br-PhO	Me	H
FCH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	H	2-Me-PhO	Me	H
CF ₃ CF ₂ CH ₂	Me	H	3-Me-PhO	Me	H
ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	H	4-Me-PhO	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
2-MeO-PhO	Me	H	A 2	Me	H
3-MeO-PhO	Me	H	A 3	Me	H
4-MeO-PhO	Me	H	A 4	Me	H
2-CF ₃ -PhO	Me	H	A 5	Me	H
3-CF ₃ -PhO	Me	H	A 6	Me	H
4-CF ₃ -PhO	Me	H	A 7	Me	H
2-NO ₂ -PhO	Me	H	A 8	Me	H
3-NO ₂ -PhO	Me	H	A 9	Me	H
4-NO ₂ -PhO	Me	H	A 10	Me	H
2-CN-PhO	Me	H	A 11	Me	H
3-CN-PhO	Me	H	A 12	Me	H
4-CN-PhO	Me	H	A 13	Me	H
NH ₂	Me	H	A 14	Me	H
NHMe	Me	H	A 15	Me	H
NMe ₂	Me	H	A 16	Me	H
NHEt	Me	H	A 17	Me	H
NEt ₂	Me	H	A 18	Me	H
NH(Pr-n)	Me	H	A 19	Me	H
N(Pr-n) ₂	Me	H	A 20	Me	H
NH(Pr-iso)	Me	H	A 21	Me	H
N(Pr-iso) ₂	Me	H	A 22	Me	H
NHCH ₂ CH=CH ₂	Me	H	A 23	Me	H
NHCH ₂ CH=CHMe	Me	H	A 24	Me	H
NHCH ₂ CMe=CH ₂	Me	H	A 25	Me	H
NHCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	A 26	Me	H
NHCH ₂ C≡CH	Me	H	A 27	Me	H
NHCH ₂ C≡CMe	Me	H	A 28	Me	H
NHOMe	Me	H	A 29	Me	H
NHOEt	Me	H	A 30	Me	H
NHOPr-n	Me	H	A 31	Me	H
NHOPr-iso	Me	H	A 32	Me	H
NMeOMe	Me	H	A 33	Me	H
NMeOEt	Me	H	A 34	Me	H
NHPh	Me	H	A 35	Me	H
NMePh	Me	H	A 36	Me	H
NHCH ₂ Ph	Me	H	A 37	Me	H
NMeCH ₂ Ph	Me	H	CH=NOMe	Me	H
A 1	Me	H	CH=NOEt	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
CH=NOPr-n	Me	H	CMe=NOCH ₂ C≡CMe	Me	H
CH=NOPr-iso	Me	H	ClCH ₂ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOBu-n	Me	H	BrCH ₂ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOBu-iso	Me	H	CCl ₃ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOBu-sec	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOBu-ter	Me	H	CCl ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	Me	H	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOCH ₂ CH=CHMe	Me	H	FCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOCH ₂ CMe=CH ₂	Me	H	CF ₃ CF ₂ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	Me	H
CH=NOCH ₂ C≡CH	Me	H	CMe=NOPr-cyc	Me	H
CH=NOCH ₂ C≡CMe	Me	H	CMe=NOBu-cyc	Me	H
ClCH ₂ CH ₂ ON=CH	Me	H	CMe=NOPen-cyc	Me	H
BrCH ₂ CH ₂ ON=CH	Me	H	CMe=NOHex-cyc	Me	H
CCl ₃ CH ₂ ON=CH	Me	H	CEt=NOMe	Me	H
CF ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CH	Me	H	CEt=NOEt	Me	H
CCl ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CH	Me	H	CEt=NOPr-n	Me	H
ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	Me	H	CEt=NOPr-iso	Me	H
FCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	Me	H	CEt=NOBu-n	Me	H
CF ₃ CF ₂ CH ₂ ON=CH	Me	H	CEt=NOBu-iso	Me	H
ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	Me	H	CEt=NOBu-sec	Me	H
CH=NOPr-cyc	Me	H	CEt=NOBu-ter	Me	H
CH=NOBu-cyc	Me	H	CEt=NOCH ₂ CH=CH ₂	Me	H
CH=NOPen-cyc	Me	H	CEt=NOCH ₂ CH=CHMe	Me	H
CH=NOHex-cyc	Me	H	CEt=NOCH ₂ CMe=CH ₂	Me	H
CMe=NOMe	Me	H	CEt=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Me	H
CMe=NOEt	Me	H	CEt=NOCH ₂ C≡CH	Me	H
CMe=NOPr-n	Me	H	CEt=NOCH ₂ C≡CMe	Me	H
CMe=NOPr-iso	Me	H	ClCH ₂ CH ₂ ON=CEt	Me	H
CMe=NOBu-n	Me	H	BrCH ₂ CH ₂ ON=CEt	Me	H
CMe=NOBu-iso	Me	H	C(Pr-n)=NOMe	Me	H
CMe=NOBu-sec	Me	H	C(Pr-n)=NOEt	Me	H
CMe=NOBu-ter	Me	H	(MeO) ₂ CH	Me	H
CMe=NOCH ₂ CH=CH ₂	Me	H	(EtO) ₂ CH	Me	H
CMe=NOCH ₂ CH=CHMe	Me	H	((Pr-n)O) ₂ CH	Me	H
CMe=NOCH ₂ CMe=CH ₂	Me	H	((Pr-iso)O) ₂ CH	Me	H
CMe=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	((Bu-n)O) ₂ CH	Me	H
CMe=NOCH ₂ C≡CH	Me	H	(MeO) ₂ CMe	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
(EtO) ₂ CMe	Me	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me
((Pr-n)O) ₂ CMe	Me	H	CH ₂ CH=CHMe	H	Me
((Pr-iso)O) ₂ CMe	Me	H	CH ₂ CMe=CH ₂	H	Me
((Bu-n)O) ₂ CMe	Me	H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	Me
(MeS) ₂ CH	Me	H	CH ₂ C≡CH	H	Me
(EtS) ₂ CH	Me	H	CH ₂ C≡CMe	H	Me
((Pr-n)S) ₂ CH	Me	H	OMe	H	Me
((Pr-iso)S) ₂ CH	Me	H	OEt	H	Me
((Bu-n)S) ₂ CH	Me	H	OPr-n	H	Me
(MeS) ₂ CMe	Me	H	OPr-iso	H	Me
(EtS) ₂ CMe	Me	H	OBu-n	H	Me
((Pr-n)S) ₂ CMe	Me	H	OBu-iso	H	Me
((Pr-iso)S) ₂ CMe	Me	H	OBu-sec	H	Me
((Bu-n)S) ₂ CMe	Me	H	OBu-ter	H	Me
B 1	Me	H	OCH ₂ CH=CH ₂	H	Me
B 2	Me	H	OCH ₂ C≡CH	H	Me
B 3	Me	H	PhCH ₂ O	H	Me
B 4	Me	H	SMe	H	Me
B 5	Me	H	SEt	H	Me
B 6	Me	H	SPr-n	H	Me
B 7	Me	H	SPr-iso	H	Me
B 8	Me	H	SBu-n	H	Me
H	H	Me	SBu-iso	H	Me
F	H	Me	SBu-sec	H	Me
Cl	H	Me	SBu-ter	H	Me
Br	H	Me	SOMe	H	Me
I	H	Me	SOEt	H	Me
CN	H	Me	SOPr-n	H	Me
NO ₂	H	Me	SOPr-iso	H	Me
OH	H	Me	SOBu-n	H	Me
Me	H	Me	SOBu-iso	H	Me
Et	H	Me	SOBu-sec	H	Me
Pr-n	H	Me	SOBu-ter	H	Me
Pr-iso	H	Me	S(O) ₂ Me	H	Me
Bu-n	H	Me	S(O) ₂ Et	H	Me
Bu-iso	H	Me	S(O) ₂ Pr-n	H	Me
Bu-sec	H	Me	S(O) ₂ Pr-iso	H	Me
Bu-ter	H	Me	S(O) ₂ Bu-n	H	Me

第5表,(続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
S(O) ₂ Bu-iso	H	Me	CH ₂ F	H	Me
S(O) ₂ Bu-sec	H	Me	CH ₂ Cl	H	Me
S(O) ₂ Bu-ter	H	Me	CH ₂ Br	H	Me
CHO	H	Me	CH ₂ I	H	Me
MeCO	H	Me	CHF ₂	H	Me
EtCO	H	Me	CHCl ₂	H	Me
(Pr-n)CO	H	Me	CBr ₂	H	Me
(Pr-iso)CO	H	Me	CF ₃	H	Me
(Bu-n)CO	H	Me	CCl ₃	H	Me
(Bu-iso)CO	H	Me	CBr ₃	H	Me
(Bu-sec)CO	H	Me	CClF ₂	H	Me
(Bu-ter)CO	H	Me	CBrF ₂	H	Me
(Pen-n)CO	H	Me	CH ₂ FCH ₂	H	Me
CO ₂ Me	H	Me	CHF ₂ CH ₂	H	Me
CO ₂ Et	H	Me	CF ₃ CH ₂	H	Me
CO ₂ Pr-n	H	Me	CF ₃ CF ₂	H	Me
CO ₂ Pr-iso	H	Me	CF ₃ CF ₂ CF ₂	H	Me
CO ₂ Bu-n	H	Me	ClCH ₂ CH ₂	H	Me
CO ₂ Bu-iso	H	Me	BrCH ₂ CH ₂	H	Me
CO ₂ Bu-sec	H	Me	CCl ₃ CH ₂	H	Me
CO ₂ Bu-ter	H	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	H	Me
CO ₂ H	H	Me	CCl ₃ CH ₂ CH ₂	H	Me
MeCOO	H	Me	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me
EtCOO	H	Me	FCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me
(Pr-n)COO	H	Me	CF ₃ CF ₂ CH ₂	H	Me
(Pr-iso)COO	H	Me	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me
(Bu-n)COO	H	Me	Ph	H	Me
(Bu-iso)COO	H	Me	2-Cl-Ph	H	Me
(Bu-sec)COO	H	Me	3-Cl-Ph	H	Me
(Bu-ter)COO	H	Me	4-Cl-Ph	H	Me
(Pen-n)COO	H	Me	2-F-Ph	H	Me
HOCH ₂	H	Me	3-F-Ph	H	Me
HOCH ₂ CH ₂	H	Me	4-F-Ph	H	Me
HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me	2-Br-Ph	H	Me
MeCH(OH)	H	Me	3-Br-Ph	H	Me
MeCH(OH)CH ₂	H	Me	4-Br-Ph	H	Me
MeCH(OH)CH ₂ CH ₂	H	Me	2-Me-Ph	H	Me
EtCH(OH)CH ₂	H	Me	3-Me-Ph	H	Me

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
4-Me-Ph	H	Me	NH ₂	H	Me
2-MeO-Ph	H	Me	NHMe	H	Me
3-MeO-Ph	H	Me	NMe ₂	H	Me
4-MeO-Ph	H	Me	NHEt	H	Me
2-CF ₃ -Ph	H	Me	NEt ₂	H	Me
3-CF ₃ -Ph	H	Me	NH(Pr-n)	H	Me
4-CF ₃ -Ph	H	Me	N(Pr-n) ₂	H	Me
2-NO ₂ -Ph	H	Me	NH(Pr-iso)	H	Me
3-NO ₂ -Ph	H	Me	N(Pr-iso) ₂	H	Me
4-NO ₂ -Ph	H	Me	NHCH ₂ CH=CH ₂	H	Me
2-CN-Ph	H	Me	NHCH ₂ CH=CHMe	H	Me
3-CN-Ph	H	Me	NHCH ₂ CMe=CH ₂	H	Me
4-CN-Ph	H	Me	NHCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	Me
PhO	H	Me	NHCH ₂ C≡CH	H	Me
2-Cl-PhO	H	Me	NHCH ₂ C≡CMe	H	Me
3-Cl-PhO	H	Me	NHOMe	H	Me
4-Cl-PhO	H	Me	NHOEt	H	Me
2-F-PhO	H	Me	NHOPr-n	H	Me
3-F-PhO	H	Me	NHOPr-iso	H	Me
4-F-PhO	H	Me	NMeOMe	H	Me
2-Br-PhO	H	Me	NMeOEt	H	Me
3-Br-PhO	H	Me	NHPh	H	Me
4-Br-PhO	H	Me	NMePh	H	Me
2-Me-PhO	H	Me	NHCH ₂ Ph	H	Me
3-Me-PhO	H	Me	NMeCH ₂ Ph	H	Me
4-Me-PhO	H	Me	A 1	H	Me
2-MeO-PhO	H	Me	A 2	H	Me
3-MeO-PhO	H	Me	A 3	H	Me
4-MeO-PhO	H	Me	A 4	H	Me
2-CF ₃ -PhO	H	Me	A 5	H	Me
3-CF ₃ -PhO	H	Me	A 6	H	Me
4-CF ₃ -PhO	H	Me	A 7	H	Me
2-NO ₂ -PhO	H	Me	A 8	H	Me
3-NO ₂ -PhO	H	Me	A 9	H	Me
4-NO ₂ -PhO	H	Me	A 1 0	H	Me
2-CN-PhO	H	Me	A 1 1	H	Me
3-CN-PhO	H	Me	A 1 2	H	Me
4-CN-PhO	H	Me	A 1 3	H	Me

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
A 1 4	H	Me	ClCH ₂ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 1 5	H	Me	BrCH ₂ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 1 6	H	Me	CCl ₃ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 1 7	H	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 1 8	H	Me	CCl ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 1 9	H	Me	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 2 0	H	Me	FCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 2 1	H	Me	CF ₃ CF ₂ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 2 2	H	Me	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CH	H	Me
A 2 3	H	Me	CH=NOPr-cyc	H	Me
A 2 4	H	Me	CH=NOBu-cyc	H	Me
A 2 5	H	Me	CH=NOPen-cyc	H	Me
A 2 6	H	Me	CH=NOHex-cyc	H	Me
A 2 7	H	Me	CMe=NOMe	H	Me
A 2 8	H	Me	CMe=NOEt	H	Me
A 2 9	H	Me	CMe=NOPr-n	H	Me
A 3 0	H	Me	CMe=NOPr-iso	H	Me
A 3 1	H	Me	CMe=NOBu-n	H	Me
A 3 2	H	Me	CMe=NOBu-iso	H	Me
A 3 3	H	Me	CMe=NOBu-sec	H	Me
A 3 4	H	Me	CMe=NOBu-ter	H	Me
A 3 5	H	Me	CMe=NOCH ₂ CH=CH ₂	H	Me
A 3 6	H	Me	CMe=NOCH ₂ CH=CHMe	H	Me
A 3 7	H	Me	CMe=NOCH ₂ CMe=CH ₂	H	Me
CH=NOMe	H	Me	CMe=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	Me
CH=NOEt	H	Me	CMe=NOCH ₂ C≡CH	H	Me
CH=NOPr-n	H	Me	CMe=NOCH ₂ C≡CMe	H	Me
CH=NOPr-iso	H	Me	ClCH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOBu-n	H	Me	BrCH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOBu-iso	H	Me	CCl ₃ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOBu-sec	H	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOBu-ter	H	Me	CCl ₃ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	H	Me	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOCH ₂ CH=CHMe	H	Me	FCH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOCH ₂ CMe=CH ₂	H	Me	CF ₃ CF ₂ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ ON=CMe	H	Me
CH=NOCH ₂ C≡CH	H	Me	CMe=NOPr-cyc	H	Me
CH=NOCH ₂ C≡CMe	H	Me	CMe=NOBu-cyc	H	Me

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
CMe=NOPen-cyc	H	Me	((Pr-iso)S) ₂ CMe	H	Me
CMe=NOHex-cyc	H	Me	((Bu-n)S) ₂ CMe	H	Me
CEt=NOMe	H	Me	B 1	H	Me
CEt=NOEt	H	Me	B 2	H	Me
CEt=NOPr-n	H	Me	B 3	H	Me
CEt=NOPr-iso	H	Me	B 4	H	Me
CEt=NOBu-n	H	Me	B 5	H	Me
CEt=NOBu-iso	H	Me	B 6	H	Me
CEt=NOBu-sec	H	Me	B 7	H	Me
CEt=NOBu-ter	H	Me	B 8	H	Me
CEt=NOCH ₂ CH=CH ₂	H	Me	Q 1	H	H
CEt=NOCH ₂ CH=CHMe	H	Me	Q 2	H	H
CEt=NOCH ₂ CMe=CH ₂	H	Me	Q 3	H	H
CEt=NOCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	Q 4	H	H
CEt=NOCH ₂ C≡CH	H	Me	Q 5	H	H
CEt=NOCH ₂ C≡CMe	H	Me	Q 6	H	H
ClCH ₂ CH ₂ ON=CEt	H	Me	Q 7	H	H
BrCH ₂ CH ₂ ON=CEt	H	Me	Q 8	H	H
C(Pr-n)=NOMe	H	Me	Q 9	H	H
C(Pr-n)=NOEt	H	Me	Q 10	H	H
(MeO) ₂ CH	H	Me	Q 11	H	H
(EtO) ₂ CH	H	Me	Q 12	H	H
((Pr-n)O) ₂ CH	H	Me	Q 13	H	H
((Pr-iso)O) ₂ CH	H	Me	Q 14	H	H
((Bu-n)O) ₂ CH	H	Me	Q 15	H	H
(MeO) ₂ CMe	H	Me	Q 16	H	H
(EtO) ₂ CMe	H	Me	Q 17	H	H
((Pr-n)O) ₂ CMe	H	Me	Q 18	H	H
((Pr-iso)O) ₂ CMe	H	Me	Q 19	H	H
((Bu-n)O) ₂ CMe	H	Me	Q 20	H	H
(MeS) ₂ CH	H	Me	Q 21	H	H
(EtS) ₂ CH	H	Me	Q 22	H	H
((Pr-n)S) ₂ CH	H	Me	Q 23	H	H
((Pr-iso)S) ₂ CH	H	Me	Q 24	H	H
((Bu-n)S) ₂ CH	H	Me	Q 25	H	H
(MeS) ₂ CMe	H	Me	Q 26	H	H
(EtS) ₂ CMe	H	Me	Q 27	H	H
((Pr-n)S) ₂ CMe	H	Me	Q 28	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q 2 9	H	H	Q 6 7	H	H
Q 3 0	H	H	Q 6 8	H	H
Q 3 1	H	H	Q 6 9	H	H
Q 3 2	H	H	Q 7 0	H	H
Q 3 3	H	H	Q 7 1	H	H
Q 3 4	H	H	Q 7 2	H	H
Q 3 5	H	H	Q 7 3	H	H
Q 3 6	H	H	Q 7 4	H	H
Q 3 7	H	H	Q 7 5	H	H
Q 3 8	H	H	Q 7 6	H	H
Q 3 9	H	H	Q 7 7	H	H
Q 4 0	H	H	Q 7 8	H	H
Q 4 1	H	H	Q 7 9	H	H
Q 4 2	H	H	Q 8 0	H	H
Q 4 3	H	H	Q 8 1	H	H
Q 4 4	H	H	Q 8 2	H	H
Q 4 5	H	H	Q 8 3	H	H
Q 4 6	H	H	Q 8 4	H	H
Q 4 7	H	H	Q 8 5	H	H
Q 4 8	H	H	Q 8 6	H	H
Q 4 9	H	H	Q 8 7	H	H
Q 5 0	H	H	Q 8 8	H	H
Q 5 1	H	H	Q 8 9	H	H
Q 5 2	H	H	Q 9 0	H	H
Q 5 3	H	H	Q 9 1	H	H
Q 5 4	H	H	Q 9 2	H	H
Q 5 5	H	H	Q 9 3	H	H
Q 5 6	H	H	Q 9 4	H	H
Q 5 7	H	H	Q 9 5	H	H
Q 5 8	H	H	Q 9 6	H	H
Q 5 9	H	H	Q 9 7	H	H
Q 6 0	H	H	Q 9 8	H	H
Q 6 1	H	H	Q 9 9	H	H
Q 6 2	H	H	Q 1 0 0	H	H
Q 6 3	H	H	Q 1	Me	H
Q 6 4	H	H	Q 2	Me	H
Q 6 5	H	H	Q 3	Me	H
Q 6 6	H	H	Q 4	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q 5	Me	H	Q 4 3	Me	H
Q 6	Me	H	Q 4 4	Me	H
Q 7	Me	H	Q 4 5	Me	H
Q 8	Me	H	Q 4 6	Me	H
Q 9	Me	H	Q 4 7	Me	H
Q 1 0	Me	H	Q 4 8	Me	H
Q 1 1	Me	H	Q 4 9	Me	H
Q 1 2	Me	H	Q 5 0	Me	H
Q 1 3	Me	H	Q 5 1	Me	H
Q 1 4	Me	H	Q 5 2	Me	H
Q 1 5	Me	H	Q 5 3	Me	H
Q 1 6	Me	H	Q 5 4	Me	H
Q 1 7	Me	H	Q 5 5	Me	H
Q 1 8	Me	H	Q 5 6	Me	H
Q 1 9	Me	H	Q 5 7	Me	H
Q 2 0	Me	H	Q 5 8	Me	H
Q 2 1	Me	H	Q 5 9	Me	H
Q 2 2	Me	H	Q 6 0	Me	H
Q 2 3	Me	H	Q 6 1	Me	H
Q 2 4	Me	H	Q 6 2	Me	H
Q 2 5	Me	H	Q 6 3	Me	H
Q 2 6	Me	H	Q 6 4	Me	H
Q 2 7	Me	H	Q 6 5	Me	H
Q 2 8	Me	H	Q 6 6	Me	H
Q 2 9	Me	H	Q 6 7	Me	H
Q 3 0	Me	H	Q 6 8	Me	H
Q 3 1	Me	H	Q 6 9	Me	H
Q 3 2	Me	H	Q 7 0	Me	H
Q 3 3	Me	H	Q 7 1	Me	H
Q 3 4	Me	H	Q 7 2	Me	H
Q 3 5	Me	H	Q 7 3	Me	H
Q 3 6	Me	H	Q 7 4	Me	H
Q 3 7	Me	H	Q 7 5	Me	H
Q 3 8	Me	H	Q 7 6	Me	H
Q 3 9	Me	H	Q 7 7	Me	H
Q 4 0	Me	H	Q 7 8	Me	H
Q 4 1	Me	H	Q 7 9	Me	H
Q 4 2	Me	H	Q 8 0	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q 8 1	Me	H	Q 1 9	H	Me
Q 8 2	Me	H	Q 2 0	H	Me
Q 8 3	Me	H	Q 2 1	H	Me
Q 8 4	Me	H	Q 2 2	H	Me
Q 8 5	Me	H	Q 2 3	H	Me
Q 8 6	Me	H	Q 2 4	H	Me
Q 8 7	Me	H	Q 2 5	H	Me
Q 8 8	Me	H	Q 2 6	H	Me
Q 8 9	Me	H	Q 2 7	H	Me
Q 9 0	Me	H	Q 2 8	H	Me
Q 9 1	Me	H	Q 2 9	H	Me
Q 9 2	Me	H	Q 3 0	H	Me
Q 9 3	Me	H	Q 3 1	H	Me
Q 9 4	Me	H	Q 3 2	H	Me
Q 9 5	Me	H	Q 3 3	H	Me
Q 9 6	Me	H	Q 3 4	H	Me
Q 9 7	Me	H	Q 3 5	H	Me
Q 9 8	Me	H	Q 3 6	H	Me
Q 9 9	Me	H	Q 3 7	H	Me
Q 1 0 0	Me	H	Q 3 8	H	Me
Q 1	H	Me	Q 3 9	H	Me
Q 2	H	Me	Q 4 0	H	Me
Q 3	H	Me	Q 4 1	H	Me
Q 4	H	Me	Q 4 2	H	Me
Q 5	H	Me	Q 4 3	H	Me
Q 6	H	Me	Q 4 4	H	Me
Q 7	H	Me	Q 4 5	H	Me
Q 8	H	Me	Q 4 6	H	Me
Q 9	H	Me	Q 4 7	H	Me
Q 1 0	H	Me	Q 4 8	H	Me
Q 1 1	H	Me	Q 4 9	H	Me
Q 1 2	H	Me	Q 5 0	H	Me
Q 1 3	H	Me	Q 5 1	H	Me
Q 1 4	H	Me	Q 5 2	H	Me
Q 1 5	H	Me	Q 5 3	H	Me
Q 1 6	H	Me	Q 5 4	H	Me
Q 1 7	H	Me	Q 5 5	H	Me
Q 1 8	H	Me	Q 5 6	H	Me

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q 5 7	H	Me	Q 9 5	H	Me
Q 5 8	H	Me	Q 9 6	H	Me
Q 5 9	H	Me	Q 9 7	H	Me
Q 6 0	H	Me	Q 9 8	H	Me
Q 6 1	H	Me	Q 9 9	H	Me
Q 6 2	H	Me	Q 1 0 0	H	Me
Q 6 3	H	Me	Q 1 0 1	H	H
Q 6 4	H	Me	Q 1 0 2	H	H
Q 6 5	H	Me	Q 1 0 3	H	H
Q 6 6	H	Me	Q 1 0 4	H	H
Q 6 7	H	Me	Q 1 0 5	H	H
Q 6 8	H	Me	Q 1 0 6	H	H
Q 6 9	H	Me	Q 1 0 7	H	H
Q 7 0	H	Me	Q 1 0 8	H	H
Q 7 1	H	Me	Q 1 0 9	H	H
Q 7 2	H	Me	Q 1 1 0	H	H
Q 7 3	H	Me	Q 1 1 1	H	H
Q 7 4	H	Me	Q 1 1 2	H	H
Q 7 5	H	Me	Q 1 0 1	Me	H
Q 7 6	H	Me	Q 1 0 2	Me	H
Q 7 7	H	Me	Q 1 0 3	Me	H
Q 7 8	H	Me	Q 1 0 4	Me	H
Q 7 9	H	Me	Q 1 0 5	Me	H
Q 8 0	H	Me	Q 1 0 6	Me	H
Q 8 1	H	Me	Q 1 0 7	Me	H
Q 8 2	H	Me	Q 1 0 8	Me	H
Q 8 3	H	Me	Q 1 0 9	Me	H
Q 8 4	H	Me	Q 1 1 0	Me	H
Q 8 5	H	Me	Q 1 1 1	Me	H
Q 8 6	H	Me	Q 1 1 2	Me	H
Q 8 7	H	Me	Q 1 0 1	H	Me
Q 8 8	H	Me	Q 1 0 2	H	Me
Q 8 9	H	Me	Q 1 0 3	H	Me
Q 9 0	H	Me	Q 1 0 4	H	Me
Q 9 1	H	Me	Q 1 0 5	H	Me
Q 9 2	H	Me	Q 1 0 6	H	Me
Q 9 3	H	Me	Q 1 0 7	H	Me
Q 9 4	H	Me	Q 1 0 8	H	Me

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q 1 0 9	H	Me	CH=CHBr	H	H
Q 1 1 0	H	Me	CH=CHBr ₂	H	H
Q 1 1 1	H	Me	MeOCH ₂	H	H
Q 1 1 2	H	Me	EtOCH ₂	H	H
CH=CH ₂	H	H	(Pr-n)OCH ₂	H	H
CH=CHMe	H	H	(Pr-iso)OCH ₂	H	H
CH=CHEt	H	H	MeOCH ₂ CH ₂	H	H
CH=CMe ₂	H	H	EtOCH ₂ CH ₂	H	H
CH=CEt ₂	H	H	Me(MeO)CH	H	H
CMe=CH ₂	H	H	Me(EtO)CH	H	H
CMe=CHMe	H	H	CH=CHOMe	H	H
CMe=CMe ₂	H	H	CH=C(OMe) ₂	H	H
CH=C=CH ₂	H	H	CH=CHOEt	H	H
C≡CH	H	H	CH=C(OEt) ₂	H	H
C≡CMe	H	H	Q59-0	H	H
C≡CEt	H	H	Q60-0	H	H
CH ₂ C≡CEt	H	H	Q61-0	H	H
CH ₂ CH ₂ C≡CH	H	H	Q62-0	H	H
CH ₂ CH ₂ C≡CMe	H	H	Q63-0	H	H
CHMeC≡CH	H	H	Q64-0	H	H
CHMeC≡CMe	H	H	Q65-0	H	H
Pr-cyc	H	H	Q66-0	H	H
Bu-cyc	H	H	Q67-0	H	H
Pen-cyc	H	H	Q68-0	H	H
Hex-cyc	H	H	Q69-0	H	H
CH ₂ (Pr-cyc)	H	H	Q70-0	H	H
CH ₂ (Bu-cyc)	H	H	Q71-0	H	H
CH ₂ (Pen-cyc)	H	H	Q113-0	H	H
CH ₂ (Hex-cyc)	H	H	Q114-0	H	H
OCH=CH ₂	H	H	Q115-0	H	H
OCH=CHMe	H	H	Q116-0	H	H
OCH ₂ CH=CHMe	H	H	Q117-0	H	H
OCH ₂ CH=CHEt	H	H	Q118-0	H	H
OCH ₂ CMe=CH ₂	H	H	Q1-CH ₂ O	H	H
OC≡CH	H	H	Q2-CH ₂ O	H	H
OC≡CMe	H	H	Q3-CH ₂ O	H	H
CH=CHCl	H	H	Q4-CH ₂ O	H	H
CH=CCl ₂	H	H	Q5-CH ₂ O	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q6-CH ₂ O	H	H	Q44-CH ₂ O	H	H
Q7-CH ₂ O	H	H	Q45-CH ₂ O	H	H
Q8-CH ₂ O	H	H	Q46-CH ₂ O	H	H
Q9-CH ₂ O	H	H	Q47-CH ₂ O	H	H
Q10-CH ₂ O	H	H	Q48-CH ₂ O	H	H
Q11-CH ₂ O	H	H	Q49-CH ₂ O	H	H
Q12-CH ₂ O	H	H	Q50-CH ₂ O	H	H
Q13-CH ₂ O	H	H	Q51-CH ₂ O	H	H
Q14-CH ₂ O	H	H	Q52-CH ₂ O	H	H
Q15-CH ₂ O	H	H	Q53-CH ₂ O	H	H
Q16-CH ₂ O	H	H	Q54-CH ₂ O	H	H
Q17-CH ₂ O	H	H	Q55-CH ₂ O	H	H
Q18-CH ₂ O	H	H	Q56-CH ₂ O	H	H
Q19-CH ₂ O	H	H	Q57-CH ₂ O	H	H
Q20-CH ₂ O	H	H	Q58-CH ₂ O	H	H
Q21-CH ₂ O	H	H	Q59-CH ₂ O	H	H
Q22-CH ₂ O	H	H	Q60-CH ₂ O	H	H
Q23-CH ₂ O	H	H	Q61-CH ₂ O	H	H
Q24-CH ₂ O	H	H	Q62-CH ₂ O	H	H
Q25-CH ₂ O	H	H	Q63-CH ₂ O	H	H
Q26-CH ₂ O	H	H	Q64-CH ₂ O	H	H
Q27-CH ₂ O	H	H	Q65-CH ₂ O	H	H
Q28-CH ₂ O	H	H	Q66-CH ₂ O	H	H
Q29-CH ₂ O	H	H	Q67-CH ₂ O	H	H
Q30-CH ₂ O	H	H	Q68-CH ₂ O	H	H
Q31-CH ₂ O	H	H	Q69-CH ₂ O	H	H
Q32-CH ₂ O	H	H	Q70-CH ₂ O	H	H
Q33-CH ₂ O	H	H	Q71-CH ₂ O	H	H
Q34-CH ₂ O	H	H	Q72-CH ₂ O	H	H
Q35-CH ₂ O	H	H	Q73-CH ₂ O	H	H
Q36-CH ₂ O	H	H	Q74-CH ₂ O	H	H
Q37-CH ₂ O	H	H	Q75-CH ₂ O	H	H
Q38-CH ₂ O	H	H	Q76-CH ₂ O	H	H
Q39-CH ₂ O	H	H	Q77-CH ₂ O	H	H
Q40-CH ₂ O	H	H	Q78-CH ₂ O	H	H
Q41-CH ₂ O	H	H	Q79-CH ₂ O	H	H
Q42-CH ₂ O	H	H	Q80-CH ₂ O	H	H
Q43-CH ₂ O	H	H	Q81-CH ₂ O	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q82-CH ₂ O	H	H	CH=CMe ₂	Me	H
Q83-CH ₂ O	H	H	CH=CEt ₂	Me	H
Q84-CH ₂ O	H	H	CMe=CH ₂	Me	H
Q85-CH ₂ O	H	H	CMe=CHMe	Me	H
Q86-CH ₂ O	H	H	CMe=CMe ₂	Me	H
Q87-CH ₂ O	H	H	CH=C=CH ₂	Me	H
Q88-CH ₂ O	H	H	C≡CH	Me	H
Q89-CH ₂ O	H	H	C≡CMe	Me	H
Q90-CH ₂ O	H	H	C≡CEt	Me	H
Q91-CH ₂ O	H	H	CH ₂ C≡CEt	Me	H
Q92-CH ₂ O	H	H	CH ₂ CH ₂ C≡CH	Me	H
Q93-CH ₂ O	H	H	CH ₂ CH ₂ C≡CMe	Me	H
Q94-CH ₂ O	H	H	CHMeC≡CH	Me	H
Q95-CH ₂ O	H	H	CHMeC≡CMe	Me	H
Q96-CH ₂ O	H	H	Pr-cyc	Me	H
Q97-CH ₂ O	H	H	Bu-cyc	Me	H
Q98-CH ₂ O	H	H	Pen-cyc	Me	H
Q99-CH ₂ O	H	H	Hex-cyc	Me	H
Q100-CH ₂ O	H	H	CH ₂ (Pr-cyc)	Me	H
Q101-CH ₂ O	H	H	CH ₂ (Bu-cyc)	Me	H
Q102-CH ₂ O	H	H	CH ₂ (Pen-cyc)	Me	H
Q103-CH ₂ O	H	H	CH ₂ (Hex-cyc)	Me	H
Q106-CH ₂ O	H	H	OCH=CH ₂	Me	H
Q107-CH ₂ O	H	H	OCH=CHMe	Me	H
Q108-CH ₂ O	H	H	OCH ₂ CH=CHMe	Me	H
Q109-CH ₂ O	H	H	OCH ₂ CH=CHEt	Me	H
Q110-CH ₂ O	H	H	OCH ₂ CMe=CH ₂	Me	H
Q111-CH ₂ O	H	H	OC≡CH	Me	H
Q112-CH ₂ O	H	H	OC≡CMe	Me	H
Q113-CH ₂ O	H	H	CH=CHCl	Me	H
Q114-CH ₂ O	H	H	CH=CCl ₂	Me	H
Q115-CH ₂ O	H	H	CH=CHBr	Me	H
Q116-CH ₂ O	H	H	CH=CHBr ₂	Me	H
Q117-CH ₂ O	H	H	MeOCH ₂	Me	H
Q118-CH ₂ O	H	H	EtOCH ₂	Me	H
CH=CH ₂	Me	H	(Pr-n)OCH ₂	Me	H
CH=CHMe	Me	H	(Pr-iso)OCH ₂	Me	H
CH=CHEt	Me	H	MeOCH ₂ CH ₂	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
EtOCH ₂ CH ₂	Me	H	Q13-CH ₂ O	Me	H
Me(MeO)CH	Me	H	Q14-CH ₂ O	Me	H
Me(EtO)CH	Me	H	Q15-CH ₂ O	Me	H
CH=CHOMe	Me	H	Q16-CH ₂ O	Me	H
CH=C(OMe) ₂	Me	H	Q17-CH ₂ O	Me	H
CH=CHOEt	Me	H	Q18-CH ₂ O	Me	H
CH=C(OEt) ₂	Me	H	Q19-CH ₂ O	Me	H
Q59-O	Me	H	Q20-CH ₂ O	Me	H
Q60-O	Me	H	Q21-CH ₂ O	Me	H
Q61-O	Me	H	Q22-CH ₂ O	Me	H
Q62-O	Me	H	Q23-CH ₂ O	Me	H
Q63-O	Me	H	Q24-CH ₂ O	Me	H
Q64-O	Me	H	Q25-CH ₂ O	Me	H
Q65-O	Me	H	Q26-CH ₂ O	Me	H
Q66-O	Me	H	Q27-CH ₂ O	Me	H
Q67-O	Me	H	Q28-CH ₂ O	Me	H
Q68-O	Me	H	Q29-CH ₂ O	Me	H
Q69-O	Me	H	Q30-CH ₂ O	Me	H
Q70-O	Me	H	Q31-CH ₂ O	Me	H
Q71-O	Me	H	Q32-CH ₂ O	Me	H
Q113-O	Me	H	Q33-CH ₂ O	Me	H
Q114-O	Me	H	Q34-CH ₂ O	Me	H
Q115-O	Me	H	Q35-CH ₂ O	Me	H
Q116-O	Me	H	Q36-CH ₂ O	Me	H
Q117-O	Me	H	Q37-CH ₂ O	Me	H
Q118-O	Me	H	Q38-CH ₂ O	Me	H
Q1-CH ₂ O	Me	H	Q39-CH ₂ O	Me	H
Q2-CH ₂ O	Me	H	Q40-CH ₂ O	Me	H
Q3-CH ₂ O	Me	H	Q41-CH ₂ O	Me	H
Q4-CH ₂ O	Me	H	Q42-CH ₂ O	Me	H
Q5-CH ₂ O	Me	H	Q43-CH ₂ O	Me	H
Q6-CH ₂ O	Me	H	Q44-CH ₂ O	Me	H
Q7-CH ₂ O	Me	H	Q45-CH ₂ O	Me	H
Q8-CH ₂ O	Me	H	Q46-CH ₂ O	Me	H
Q9-CH ₂ O	Me	H	Q47-CH ₂ O	Me	H
Q10-CH ₂ O	Me	H	Q48-CH ₂ O	Me	H
Q11-CH ₂ O	Me	H	Q49-CH ₂ O	Me	H
Q12-CH ₂ O	Me	H	Q50-CH ₂ O	Me	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q51-CH ₂ O	Me	H	Q89-CH ₂ O	Me	H
Q52-CH ₂ O	Me	H	Q90-CH ₂ O	Me	H
Q53-CH ₂ O	Me	H	Q91-CH ₂ O	Me	H
Q54-CH ₂ O	Me	H	Q92-CH ₂ O	Me	H
Q55-CH ₂ O	Me	H	Q93-CH ₂ O	Me	H
Q56-CH ₂ O	Me	H	Q94-CH ₂ O	Me	H
Q57-CH ₂ O	Me	H	Q95-CH ₂ O	Me	H
Q58-CH ₂ O	Me	H	Q96-CH ₂ O	Me	H
Q59-CH ₂ O	Me	H	Q97-CH ₂ O	Me	H
Q60-CH ₂ O	Me	H	Q98-CH ₂ O	Me	H
Q61-CH ₂ O	Me	H	Q99-CH ₂ O	Me	H
Q62-CH ₂ O	Me	H	Q100-CH ₂ O	Me	H
Q63-CH ₂ O	Me	H	Q101-CH ₂ O	Me	H
Q64-CH ₂ O	Me	H	Q102-CH ₂ O	Me	H
Q65-CH ₂ O	Me	H	Q103-CH ₂ O	Me	H
Q66-CH ₂ O	Me	H	Q106-CH ₂ O	Me	H
Q67-CH ₂ O	Me	H	Q107-CH ₂ O	Me	H
Q68-CH ₂ O	Me	H	Q108-CH ₂ O	Me	H
Q69-CH ₂ O	Me	H	Q109-CH ₂ O	Me	H
Q70-CH ₂ O	Me	H	Q110-CH ₂ O	Me	H
Q71-CH ₂ O	Me	H	Q111-CH ₂ O	Me	H
Q72-CH ₂ O	Me	H	Q112-CH ₂ O	Me	H
Q73-CH ₂ O	Me	H	Q113-CH ₂ O	Me	H
Q74-CH ₂ O	Me	H	Q114-CH ₂ O	Me	H
Q75-CH ₂ O	Me	H	Q115-CH ₂ O	Me	H
Q76-CH ₂ O	Me	H	Q116-CH ₂ O	Me	H
Q77-CH ₂ O	Me	H	Q117-CH ₂ O	Me	H
Q78-CH ₂ O	Me	H	Q118-CH ₂ O	Me	H
Q79-CH ₂ O	Me	H	CH=CH ₂	H	Me
Q80-CH ₂ O	Me	H	CH=CHMe	H	Me
Q81-CH ₂ O	Me	H	CH=CHEt	H	Me
Q82-CH ₂ O	Me	H	CH=CMe ₂	H	Me
Q83-CH ₂ O	Me	H	CH=CEt ₂	H	Me
Q84-CH ₂ O	Me	H	CMe=CH ₂	H	Me
Q85-CH ₂ O	Me	H	CMe=CHMe	H	Me
Q86-CH ₂ O	Me	H	CMe=CMe ₂	H	Me
Q87-CH ₂ O	Me	H	CH=C=CH ₂	H	Me
Q88-CH ₂ O	Me	H	C≡CH	H	Me

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
$C \equiv CMe$	H	Me	Q59-0	H	Me
$C \equiv CEt$	H	Me	Q60-0	H	Me
$CH_2C \equiv CEt$	H	Me	Q61-0	H	Me
$CH_2CH_2C \equiv CH$	H	Me	Q62-0	H	Me
$CH_2CH_2C \equiv CMe$	H	Me	Q63-0	H	Me
$CHMeC \equiv CH$	H	Me	Q64-0	H	Me
$CHMeC \equiv CMe$	H	Me	Q65-0	H	Me
Pr-cyc	H	Me	Q66-0	H	Me
Bu-cyc	H	Me	Q67-0	H	Me
Pen-cyc	H	Me	Q68-0	H	Me
Hex-cyc	H	Me	Q69-0	H	Me
CH_2 (Pr-cyc)	H	Me	Q70-0	H	Me
CH_2 (Bu-cyc)	H	Me	Q71-0	H	Me
CH_2 (Pen-cyc)	H	Me	Q113-0	H	Me
CH_2 (Hex-cyc)	H	Me	Q114-0	H	Me
$OCH=CH_2$	H	Me	Q115-0	H	Me
$OCH=CHMe$	H	Me	Q116-0	H	Me
$OCH_2CH=CHMe$	H	Me	Q117-0	H	Me
$OCH_2CH=CHEt$	H	Me	Q118-0	H	Me
$OCH_2CMe=CH_2$	H	Me	Q1-CH ₂ O	H	Me
$OC \equiv CH$	H	Me	Q2-CH ₂ O	H	Me
$OC \equiv CMe$	H	Me	Q3-CH ₂ O	H	Me
$CH=CHCl$	H	Me	Q4-CH ₂ O	H	Me
$CH=CCl_2$	H	Me	Q5-CH ₂ O	H	Me
$CH=CHBr$	H	Me	Q6-CH ₂ O	H	Me
$CH=CBr_2$	H	Me	Q7-CH ₂ O	H	Me
MeOCH ₂	H	Me	Q8-CH ₂ O	H	Me
EtOCH ₂	H	Me	Q9-CH ₂ O	H	Me
(Pr-n)OCH ₂	H	Me	Q10-CH ₂ O	H	Me
(Pr-iso)OCH ₂	H	Me	Q11-CH ₂ O	H	Me
MeOCH ₂ CH ₂	H	Me	Q12-CH ₂ O	H	Me
EtOCH ₂ CH ₂	H	Me	Q13-CH ₂ O	H	Me
Me(MeO)CH	H	Me	Q14-CH ₂ O	H	Me
Me(EtO)CH	H	Me	Q15-CH ₂ O	H	Me
CH=CHOMe	H	Me	Q16-CH ₂ O	H	Me
$CH=C(OMe)_2$	H	Me	Q17-CH ₂ O	H	Me
$CH=CHOEt$	H	Me	Q18-CH ₂ O	H	Me
$CH=C(OEt)_2$	H	Me	Q19-CH ₂ O	H	Me

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q20-CH ₂ O	H	Me	Q58-CH ₂ O	H	Me
Q21-CH ₂ O	H	Me	Q59-CH ₂ O	H	Me
Q22-CH ₂ O	H	Me	Q60-CH ₂ O	H	Me
Q23-CH ₂ O	H	Me	Q61-CH ₂ O	H	Me
Q24-CH ₂ O	H	Me	Q62-CH ₂ O	H	Me
Q25-CH ₂ O	H	Me	Q63-CH ₂ O	H	Me
Q26-CH ₂ O	H	Me	Q64-CH ₂ O	H	Me
Q27-CH ₂ O	H	Me	Q65-CH ₂ O	H	Me
Q28-CH ₂ O	H	Me	Q66-CH ₂ O	H	Me
Q29-CH ₂ O	H	Me	Q67-CH ₂ O	H	Me
Q30-CH ₂ O	H	Me	Q68-CH ₂ O	H	Me
Q31-CH ₂ O	H	Me	Q69-CH ₂ O	H	Me
Q32-CH ₂ O	H	Me	Q70-CH ₂ O	H	Me
Q33-CH ₂ O	H	Me	Q71-CH ₂ O	H	Me
Q34-CH ₂ O	H	Me	Q72-CH ₂ O	H	Me
Q35-CH ₂ O	H	Me	Q73-CH ₂ O	H	Me
Q36-CH ₂ O	H	Me	Q74-CH ₂ O	H	Me
Q37-CH ₂ O	H	Me	Q75-CH ₂ O	H	Me
Q38-CH ₂ O	H	Me	Q76-CH ₂ O	H	Me
Q39-CH ₂ O	H	Me	Q77-CH ₂ O	H	Me
Q40-CH ₂ O	H	Me	Q78-CH ₂ O	H	Me
Q41-CH ₂ O	H	Me	Q79-CH ₂ O	H	Me
Q42-CH ₂ O	H	Me	Q80-CH ₂ O	H	Me
Q43-CH ₂ O	H	Me	Q81-CH ₂ O	H	Me
Q44-CH ₂ O	H	Me	Q82-CH ₂ O	H	Me
Q45-CH ₂ O	H	Me	Q83-CH ₂ O	H	Me
Q46-CH ₂ O	H	Me	Q84-CH ₂ O	H	Me
Q47-CH ₂ O	H	Me	Q85-CH ₂ O	H	Me
Q48-CH ₂ O	H	Me	Q86-CH ₂ O	H	Me
Q49-CH ₂ O	H	Me	Q87-CH ₂ O	H	Me
Q50-CH ₂ O	H	Me	Q88-CH ₂ O	H	Me
Q51-CH ₂ O	H	Me	Q89-CH ₂ O	H	Me
Q52-CH ₂ O	H	Me	Q90-CH ₂ O	H	Me
Q53-CH ₂ O	H	Me	Q91-CH ₂ O	H	Me
Q54-CH ₂ O	H	Me	Q92-CH ₂ O	H	Me
Q55-CH ₂ O	H	Me	Q93-CH ₂ O	H	Me
Q56-CH ₂ O	H	Me	Q94-CH ₂ O	H	Me
Q57-CH ₂ O	H	Me	Q95-CH ₂ O	H	Me

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q96-CH ₂ O	H	Me	Q134	H	H
Q97-CH ₂ O	H	Me	Q135	H	H
Q98-CH ₂ O	H	Me	Q136	H	H
Q99-CH ₂ O	H	Me	Q137	H	H
Q100-CH ₂ O	H	Me	Q138	H	H
Q101-CH ₂ O	H	Me	Q139	H	H
Q102-CH ₂ O	H	Me	Q140	H	H
Q103-CH ₂ O	H	Me	Q141	H	H
Q106-CH ₂ O	H	Me	Q142	H	H
Q107-CH ₂ O	H	Me	Q143	H	H
Q108-CH ₂ O	H	Me	Q144	H	H
Q109-CH ₂ O	H	Me	Q1-CH ₂	H	H
Q110-CH ₂ O	H	Me	Q2-CH ₂	H	H
Q111-CH ₂ O	H	Me	Q3-CH ₂	H	H
Q112-CH ₂ O	H	Me	Q4-CH ₂	H	H
Q113-CH ₂ O	H	Me	Q5-CH ₂	H	H
Q114-CH ₂ O	H	Me	Q6-CH ₂	H	H
Q115-CH ₂ O	H	Me	Q7-CH ₂	H	H
Q116-CH ₂ O	H	Me	Q8-CH ₂	H	H
Q117-CH ₂ O	H	Me	Q9-CH ₂	H	H
Q118-CH ₂ O	H	Me	Q10-CH ₂	H	H
SH	H	H	Q11-CH ₂	H	H
CO ₂ CH ₂ Ph	H	H	Q12-CH ₂	H	H
Q119	H	H	Q13-CH ₂	H	H
Q120	H	H	Q14-CH ₂	H	H
Q121	H	H	Q15-CH ₂	H	H
Q122	H	H	Q16-CH ₂	H	H
Q123	H	H	Q17-CH ₂	H	H
Q124	H	H	Q18-CH ₂	H	H
Q125	H	H	Q19-CH ₂	H	H
Q126	H	H	Q20-CH ₂	H	H
Q127	H	H	Q21-CH ₂	H	H
Q128	H	H	Q22-CH ₂	H	H
Q129	H	H	Q23-CH ₂	H	H
Q130	H	H	Q24-CH ₂	H	H
Q131	H	H	Q25-CH ₂	H	H
Q132	H	H	Q26-CH ₂	H	H
Q133	H	H	Q27-CH ₂	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q28-CH ₂	H	H	Q66-CH ₂	H	H
Q29-CH ₂	H	H	Q67-CH ₂	H	H
Q30-CH ₂	H	H	Q68-CH ₂	H	H
Q31-CH ₂	H	H	Q69-CH ₂	H	H
Q32-CH ₂	H	H	Q70-CH ₂	H	H
Q33-CH ₂	H	H	Q71-CH ₂	H	H
Q34-CH ₂	H	H	Q72-CH ₂	H	H
Q35-CH ₂	H	H	Q73-CH ₂	H	H
Q36-CH ₂	H	H	Q74-CH ₂	H	H
Q37-CH ₂	H	H	Q75-CH ₂	H	H
Q38-CH ₂	H	H	Q76-CH ₂	H	H
Q39-CH ₂	H	H	Q77-CH ₂	H	H
Q40-CH ₂	H	H	Q78-CH ₂	H	H
Q41-CH ₂	H	H	Q79-CH ₂	H	H
Q42-CH ₂	H	H	Q80-CH ₂	H	H
Q43-CH ₂	H	H	Q81-CH ₂	H	H
Q44-CH ₂	H	H	Q82-CH ₂	H	H
Q45-CH ₂	H	H	Q83-CH ₂	H	H
Q46-CH ₂	H	H	Q84-CH ₂	H	H
Q47-CH ₂	H	H	Q85-CH ₂	H	H
Q48-CH ₂	H	H	Q86-CH ₂	H	H
Q49-CH ₂	H	H	Q87-CH ₂	H	H
Q50-CH ₂	H	H	Q88-CH ₂	H	H
Q51-CH ₂	H	H	Q89-CH ₂	H	H
Q52-CH ₂	H	H	Q90-CH ₂	H	H
Q53-CH ₂	H	H	Q91-CH ₂	H	H
Q54-CH ₂	H	H	Q92-CH ₂	H	H
Q55-CH ₂	H	H	Q93-CH ₂	H	H
Q56-CH ₂	H	H	Q94-CH ₂	H	H
Q57-CH ₂	H	H	Q95-CH ₂	H	H
Q58-CH ₂	H	H	Q96-CH ₂	H	H
Q59-CH ₂	H	H	Q97-CH ₂	H	H
Q60-CH ₂	H	H	Q98-CH ₂	H	H
Q61-CH ₂	H	H	Q99-CH ₂	H	H
Q62-CH ₂	H	H	Q100-CH ₂	H	H
Q63-CH ₂	H	H	Q113-CH ₂	H	H
Q64-CH ₂	H	H	Q114-CH ₂	H	H
Q65-CH ₂	H	H	Q115-CH ₂	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q116-CH ₂	H	H	Q128-CH ₂ O	H	H
Q117-CH ₂	H	H	Q129-CH ₂ O	H	H
Q118-CH ₂	H	H	Q130-CH ₂ O	H	H
Q119-CH ₂	H	H	Q131-CH ₂ O	H	H
Q120-CH ₂	H	H	Q132-CH ₂ O	H	H
Q121-CH ₂	H	H	Q133-CH ₂ O	H	H
Q122-CH ₂	H	H	Q134-CH ₂ O	H	H
Q123-CH ₂	H	H	Q135-CH ₂ O	H	H
Q124-CH ₂	H	H	Q136-CH ₂ O	H	H
Q125-CH ₂	H	H	Q137-CH ₂ O	H	H
Q126-CH ₂	H	H	Q138-CH ₂ O	H	H
Q127-CH ₂	H	H	Q139-CH ₂ O	H	H
Q128-CH ₂	H	H	Q140-CH ₂ O	H	H
Q129-CH ₂	H	H	Q141-CH ₂ O	H	H
Q130-CH ₂	H	H	Q142-CH ₂ O	H	H
Q131-CH ₂	H	H	Q143-CH ₂ O	H	H
Q132-CH ₂	H	H	Q144-CH ₂ O	H	H
Q133-CH ₂	H	H	Q59-S	H	H
Q134-CH ₂	H	H	Q60-S	H	H
Q135-CH ₂	H	H	Q61-S	H	H
Q136-CH ₂	H	H	Q62-S	H	H
Q137-CH ₂	H	H	Q63-S	H	H
Q138-CH ₂	H	H	Q64-S	H	H
Q139-CH ₂	H	H	Q65-S	H	H
Q140-CH ₂	H	H	Q66-S	H	H
Q141-CH ₂	H	H	Q67-S	H	H
Q142-CH ₂	H	H	Q68-S	H	H
Q143-CH ₂	H	H	Q69-S	H	H
Q144-CH ₂	H	H	Q70-S	H	H
Q119-CH ₂ O	H	H	Q71-S	H	H
Q120-CH ₂ O	H	H	Q113-S	H	H
Q121-CH ₂ O	H	H	Q114-S	H	H
Q122-CH ₂ O	H	H	Q115-S	H	H
Q123-CH ₂ O	H	H	Q116-S	H	H
Q124-CH ₂ O	H	H	Q117-S	H	H
Q125-CH ₂ O	H	H	Q118-S	H	H
Q126-CH ₂ O	H	H	Q119-S	H	H
Q127-CH ₂ O	H	H	Q120-S	H	H

第5表 (続き)

R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q121-S	H	H	Q15-CH ₂ S	H	H
Q122-S	H	H	Q16-CH ₂ S	H	H
Q123-S	H	H	Q17-CH ₂ S	H	H
Q124-S	H	H	Q18-CH ₂ S	H	H
Q125-S	H	H	Q19-CH ₂ S	H	H
Q126-S	H	H	Q20-CH ₂ S	H	H
Q127-S	H	H	Q21-CH ₂ S	H	H
Q128-S	H	H	Q22-CH ₂ S	H	H
Q129-S	H	H	Q23-CH ₂ S	H	H
Q130-S	H	H	Q24-CH ₂ S	H	H
Q131-S	H	H	Q25-CH ₂ S	H	H
Q132-S	H	H	Q26-CH ₂ S	H	H
Q133-S	H	H	Q27-CH ₂ S	H	H
Q134-S	H	H	Q28-CH ₂ S	H	H
Q135-S	H	H	Q29-CH ₂ S	H	H
Q136-S	H	H	Q30-CH ₂ S	H	H
Q137-S	H	H	Q31-CH ₂ S	H	H
Q138-S	H	H	Q32-CH ₂ S	H	H
Q139-S	H	H	Q33-CH ₂ S	H	H
Q140-S	H	H	Q34-CH ₂ S	H	H
Q141-S	H	H	Q35-CH ₂ S	H	H
Q142-S	H	H	Q36-CH ₂ S	H	H
Q143-S	H	H	Q37-CH ₂ S	H	H
Q144-S	H	H	Q38-CH ₂ S	H	H
Q1-CH ₂ S	H	H	Q39-CH ₂ S	H	H
Q2-CH ₂ S	H	H	Q40-CH ₂ S	H	H
Q3-CH ₂ S	H	H	Q41-CH ₂ S	H	H
Q4-CH ₂ S	H	H	Q42-CH ₂ S	H	H
Q5-CH ₂ S	H	H	Q43-CH ₂ S	H	H
Q6-CH ₂ S	H	H	Q44-CH ₂ S	H	H
Q7-CH ₂ S	H	H	Q45-CH ₂ S	H	H
Q8-CH ₂ S	H	H	Q46-CH ₂ S	H	H
Q9-CH ₂ S	H	H	Q47-CH ₂ S	H	H
Q10-CH ₂ S	H	H	Q48-CH ₂ S	H	H
Q11-CH ₂ S	H	H	Q49-CH ₂ S	H	H
Q12-CH ₂ S	H	H	Q50-CH ₂ S	H	H
Q13-CH ₂ S	H	H	Q51-CH ₂ S	H	H
Q14-CH ₂ S	H	H	Q52-CH ₂ S	H	H

第5表 (続き)

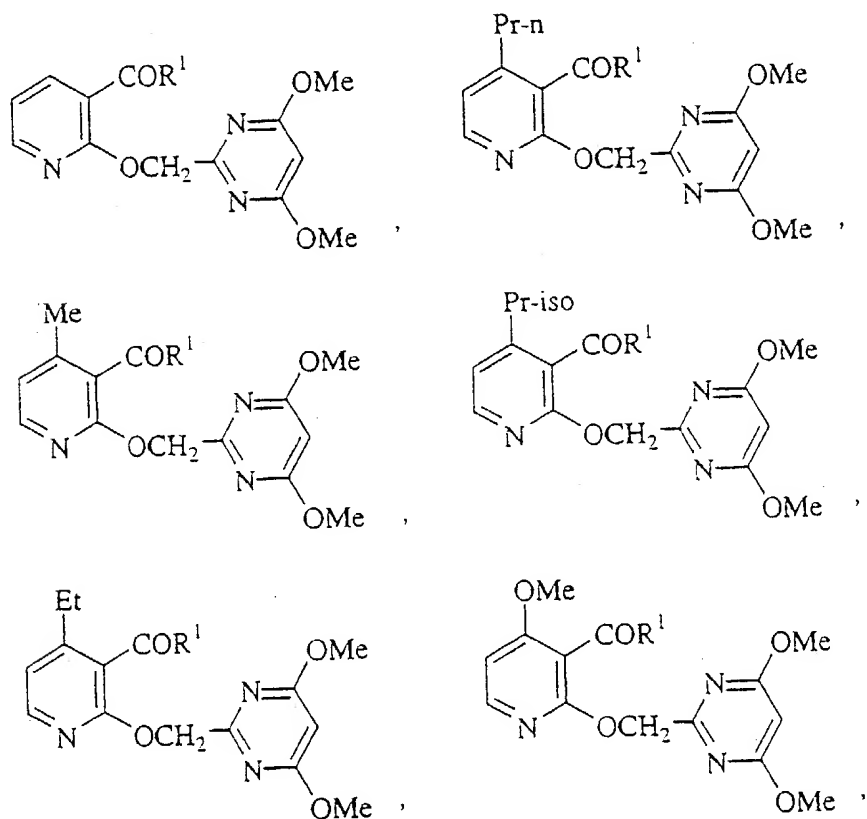
R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q53-CH ₂ S	H	H	Q91-CH ₂ S	H	H
Q54-CH ₂ S	H	H	Q92-CH ₂ S	H	H
Q55-CH ₂ S	H	H	Q93-CH ₂ S	H	H
Q56-CH ₂ S	H	H	Q94-CH ₂ S	H	H
Q57-CH ₂ S	H	H	Q95-CH ₂ S	H	H
Q58-CH ₂ S	H	H	Q96-CH ₂ S	H	H
Q59-CH ₂ S	H	H	Q97-CH ₂ S	H	H
Q60-CH ₂ S	H	H	Q98-CH ₂ S	H	H
Q61-CH ₂ S	H	H	Q99-CH ₂ S	H	H
Q62-CH ₂ S	H	H	Q100-CH ₂ S	H	H
Q63-CH ₂ S	H	H	Q113-CH ₂ S	H	H
Q64-CH ₂ S	H	H	Q114-CH ₂ S	H	H
Q65-CH ₂ S	H	H	Q115-CH ₂ S	H	H
Q66-CH ₂ S	H	H	Q116-CH ₂ S	H	H
Q67-CH ₂ S	H	H	Q117-CH ₂ S	H	H
Q68-CH ₂ S	H	H	Q118-CH ₂ S	H	H
Q69-CH ₂ S	H	H	Q119-CH ₂ S	H	H
Q70-CH ₂ S	H	H	Q120-CH ₂ S	H	H
Q71-CH ₂ S	H	H	Q121-CH ₂ S	H	H
Q72-CH ₂ S	H	H	Q122-CH ₂ S	H	H
Q73-CH ₂ S	H	H	Q123-CH ₂ S	H	H
Q74-CH ₂ S	H	H	Q124-CH ₂ S	H	H
Q75-CH ₂ S	H	H	Q125-CH ₂ S	H	H
Q76-CH ₂ S	H	H	Q126-CH ₂ S	H	H
Q77-CH ₂ S	H	H	Q127-CH ₂ S	H	H
Q78-CH ₂ S	H	H	Q128-CH ₂ S	H	H
Q79-CH ₂ S	H	H	Q129-CH ₂ S	H	H
Q80-CH ₂ S	H	H	Q130-CH ₂ S	H	H
Q81-CH ₂ S	H	H	Q131-CH ₂ S	H	H
Q82-CH ₂ S	H	H	Q132-CH ₂ S	H	H
Q83-CH ₂ S	H	H	Q133-CH ₂ S	H	H
Q84-CH ₂ S	H	H	Q134-CH ₂ S	H	H
Q85-CH ₂ S	H	H	Q135-CH ₂ S	H	H
Q86-CH ₂ S	H	H	Q136-CH ₂ S	H	H
Q87-CH ₂ S	H	H	Q137-CH ₂ S	H	H
Q88-CH ₂ S	H	H	Q138-CH ₂ S	H	H
Q89-CH ₂ S	H	H	Q139-CH ₂ S	H	H
Q90-CH ₂ S	H	H	Q140-CH ₂ S	H	H

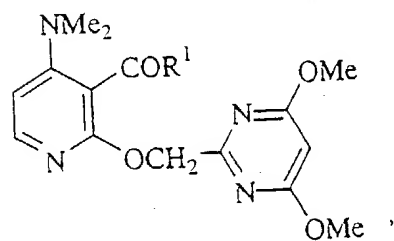
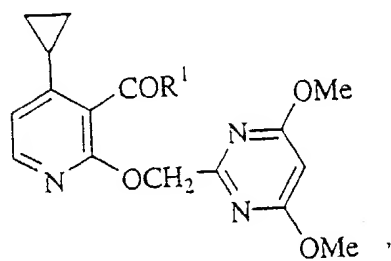
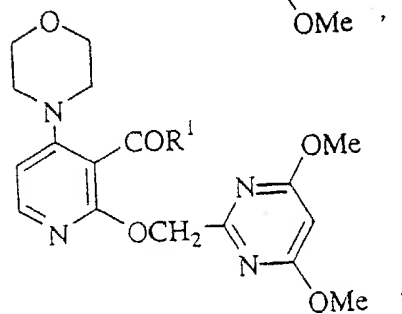
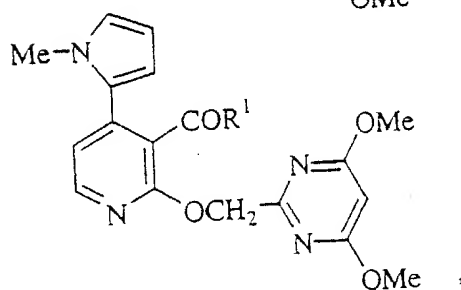
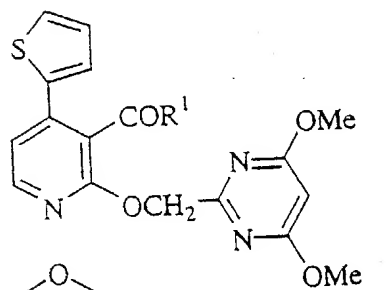
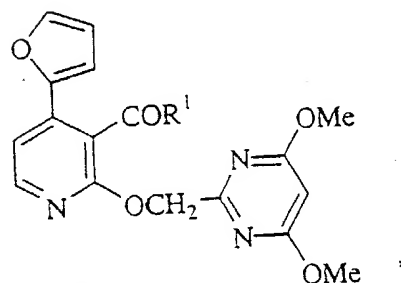
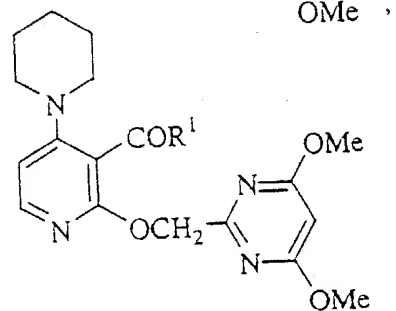
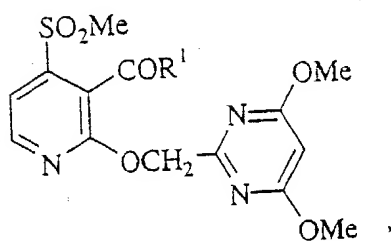
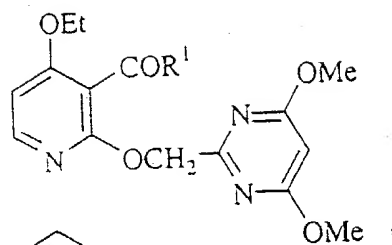
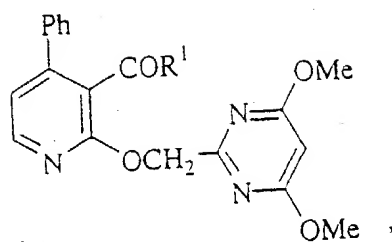
第5表 (続き)

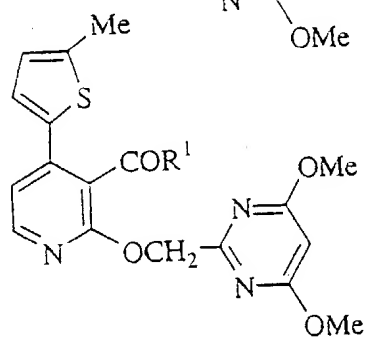
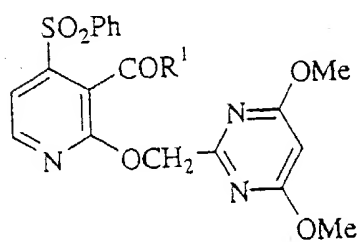
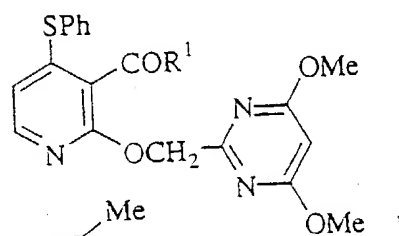
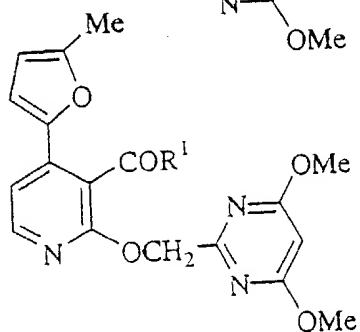
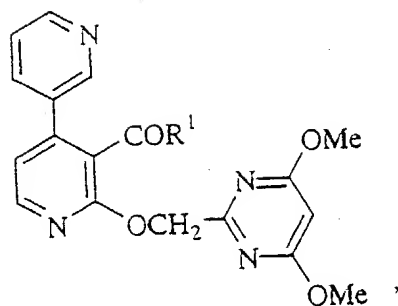
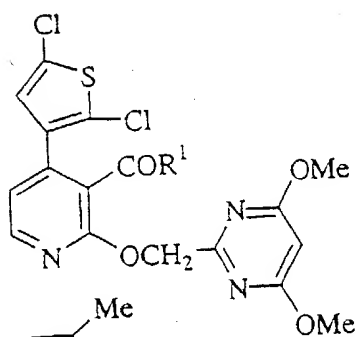
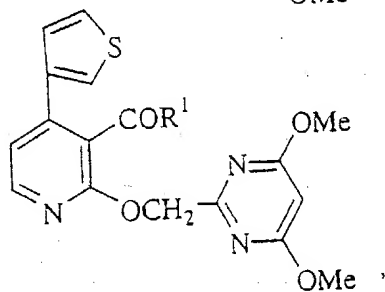
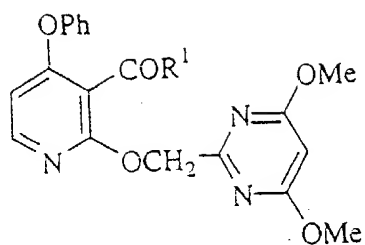
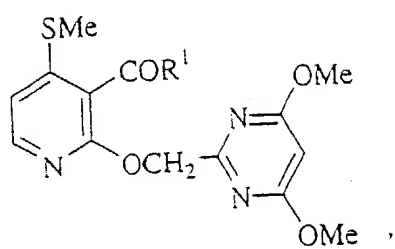
R a	R b	R c	R a	R b	R c
Q141-CH ₂ S	H	H	CONMe ₂	H	H
Q142-CH ₂ S	H	H	CONEt ₂	H	H
Q143-CH ₂ S	H	H	CO-A4	H	H
Q144-CH ₂ S	H	H	CO-A5	H	H
CONH ₂	H	H	CO-A6	H	H
CONHMe	H	H	CO-A14	H	H
CONHEt	H	H	CO-A33	H	H
CONH(Bu-n)	H	H	N ₃	H	H
CONHCH ₂ CH=CH ₂	H	H	CH ₂ N ₃	H	H
CONHCH ₂ C≡CH	H	H			

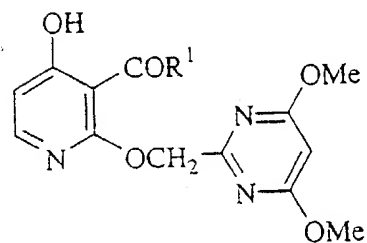
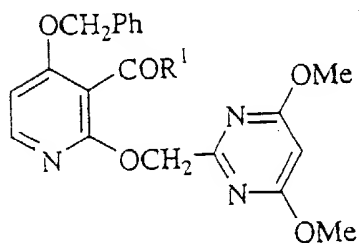
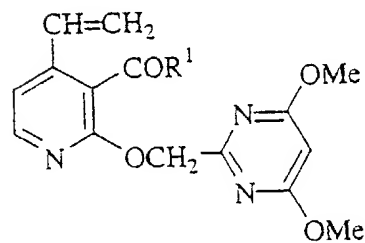
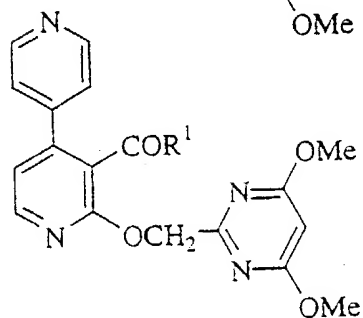
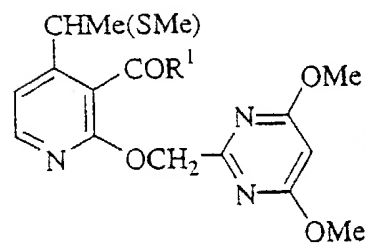
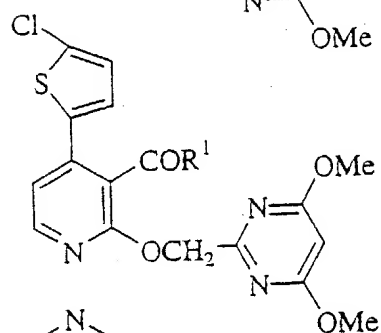
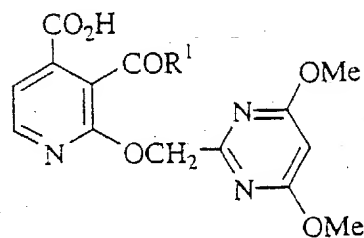
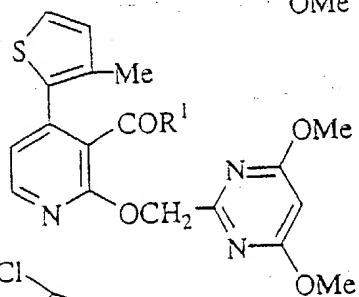
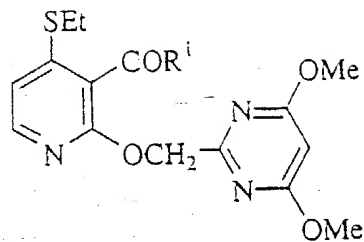
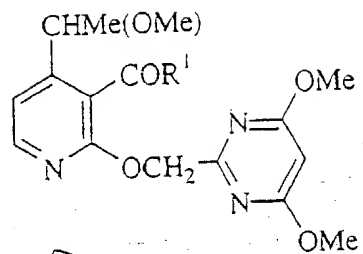
第6表

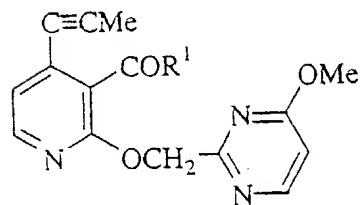
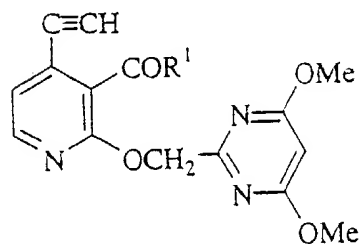
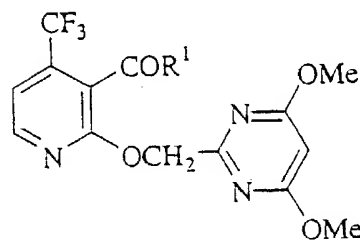
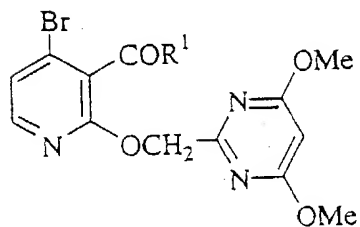
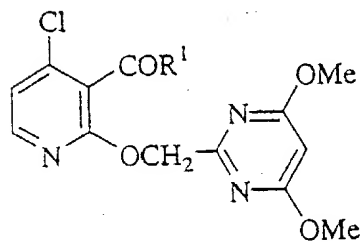
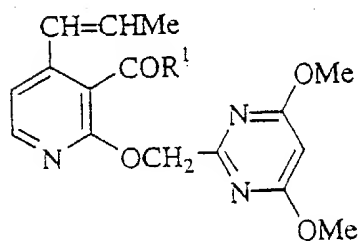
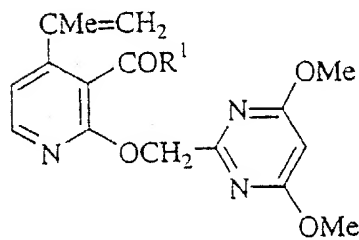
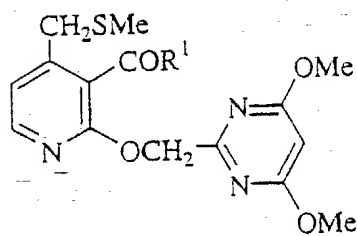
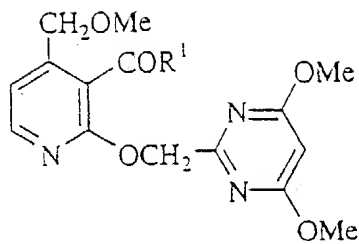
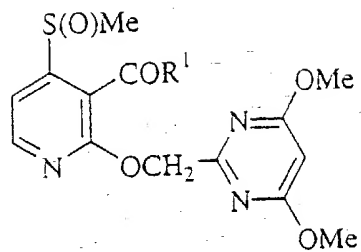
5

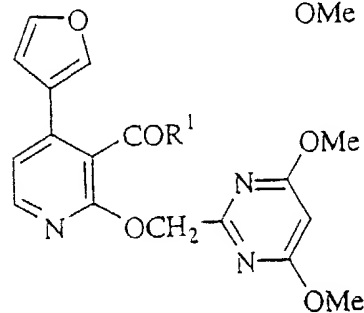
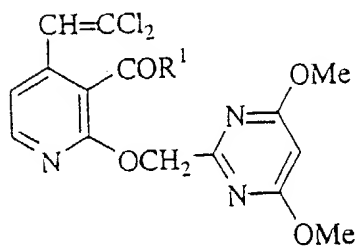
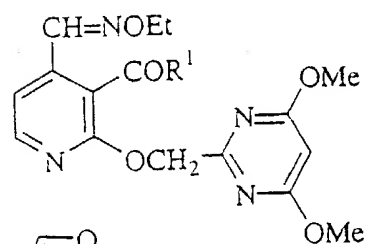
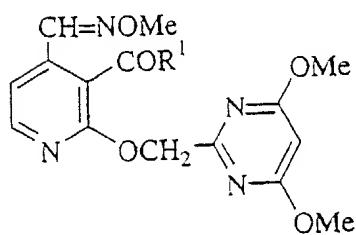
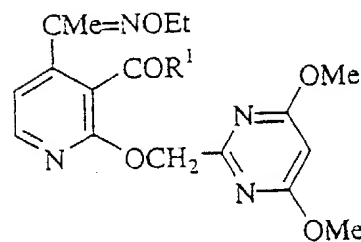
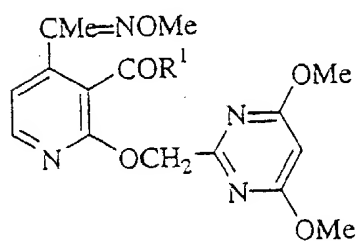
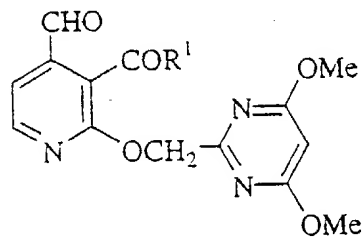
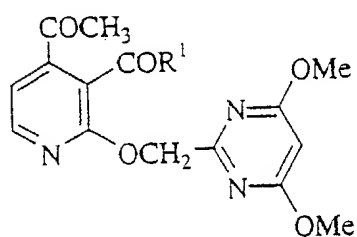
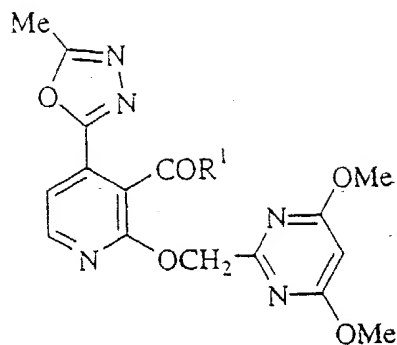
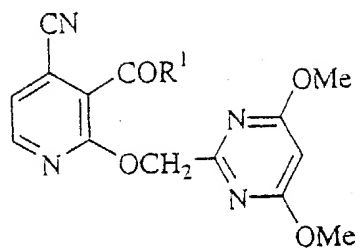


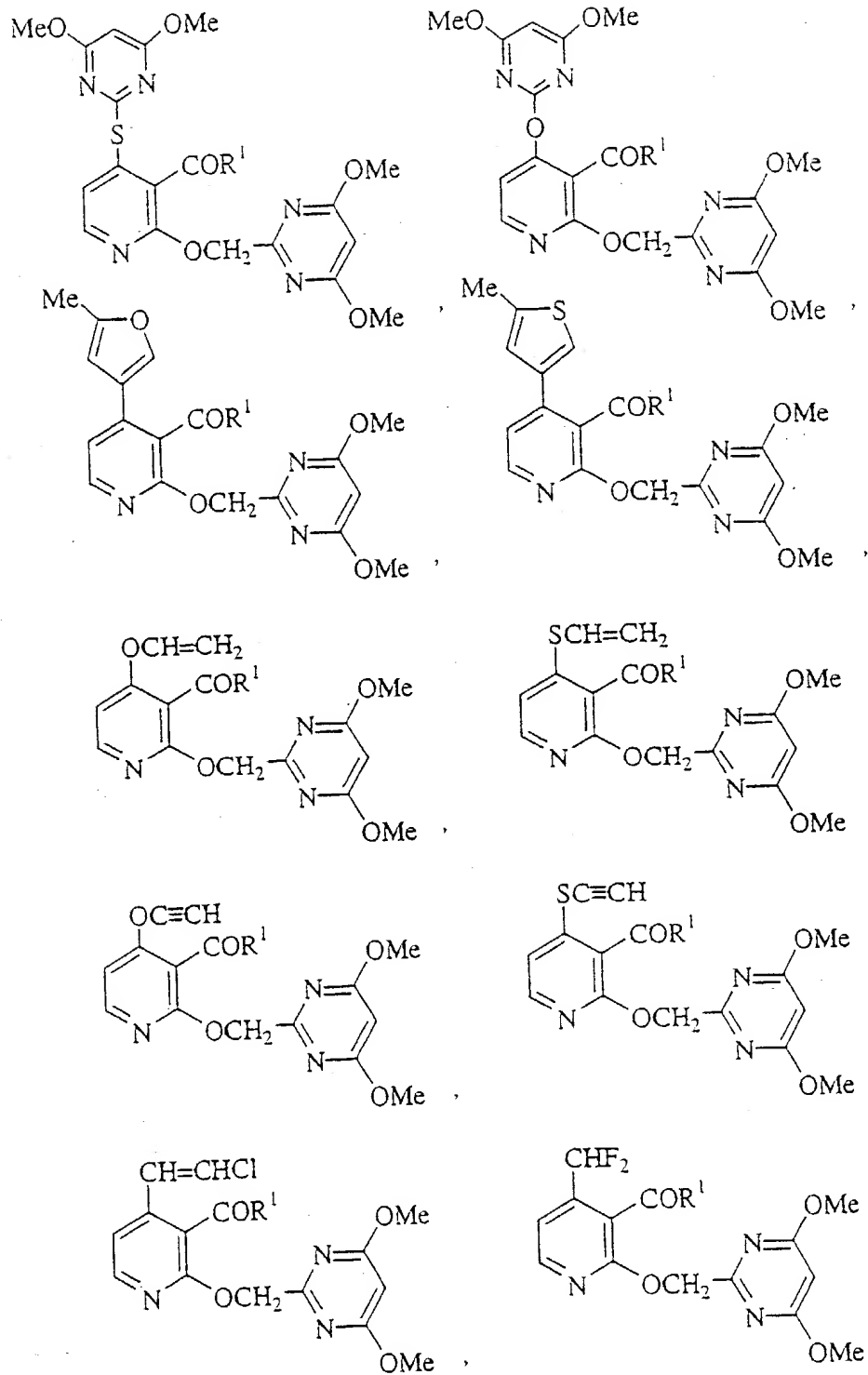


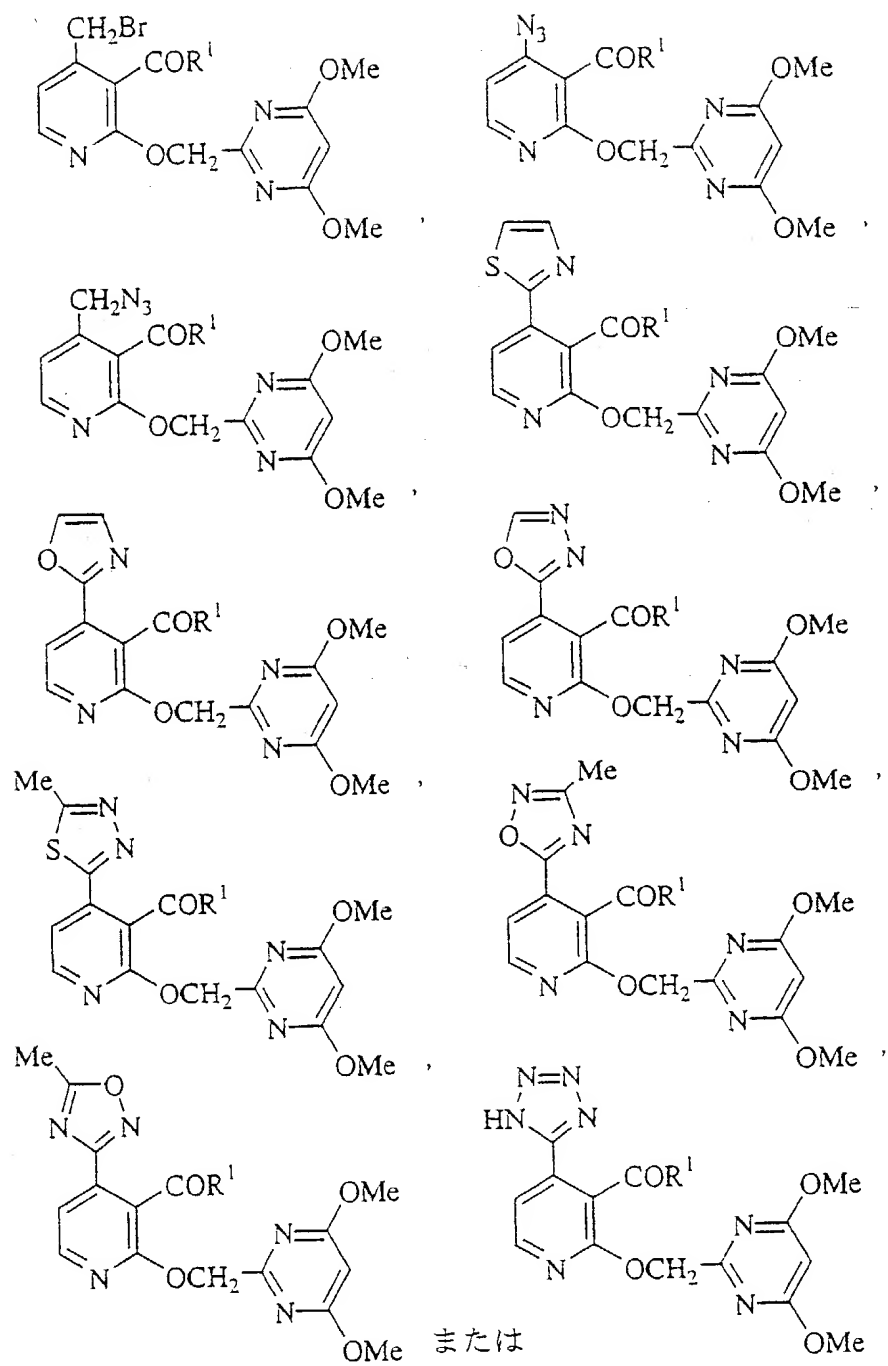












R¹

- H, OPr-n, OPr-iso, OBU-n, OBU-iso, OBU-sec, OBU-tert, OPen-n, Et₂CHO,
 5 OHex-n, OCH₂CH=CH₂, OCH₂CH=CHMe, OCH₂CH=CHEt, OCH₂CMe=CH₂, OCH₂CH₂CH=CH
₂, OCH₂CH₂CH=CHMe, OCH₂CH=CMe₂, OCHMeCH=CH₂, OCH₂CMe=CHMe, OCHMeCH=CHMe,
 OCH₂CMe=CHEt, OCH₂CH₂CH=CMe₂, OCH₂CMe=CMe₂, OCH₂C≡CH, OCH₂C≡CMe, OCH₂
 C≡CEt, OCH₂CH₂C≡CH, OCH₂CH₂C≡CMe, OCHMeC≡CH, OCHMeC≡CMe, PhCH₂O,
 SMe, SEt, SPr-n, SPr-iso, SBU-n, SBU-iso, SBU-sec, SBU-tert, SPen-n, Et
 10 ₂CHS, SHex-n, NHSO₂Me, NHSO₂Et, NHSO₂Pr-n, NHSO₂Pr-iso, NHSO₂BU-n, NHSO
₂BU-iso, NHSO₂BU-sec, NHSO₂BU-tert, NHSO₂Pen-n, NHSO₂Hex-n, OCF₂CF₃,
 OCH₂CF₃, OCH₂CHF₂, OCH₂CH₂F, OCH₂CH₂Cl, OCH₂CH₂Br, OCH₂OPr-n, OCH₂OPr-
 iso, OCH₂OBu-n, OCH₂OBu-iso, OCH₂OBu-sec, OCH₂OBu-tert, OCH₂CH₂OMe, OCH
₂CH₂OEt, OCH₂CH₂OPr-n, OCH₂CH₂CH₂OMe, OCH₂CH₂CH₂OEt, OCH₂CH₂CH₂CH₂OMe,
 15 Me, Et, Pr-n, Pr-iso, BU-n, BU-iso, BU-sec, BU-tert, Pen-n, Et₂CH, Hex-
 n, Me(Pr-n)CH, Me(BU-n)CH, Et(Pr-n)CH, Me₂CHCH₂CH₂, O⁻Ca²⁺_{1/2}, O⁻NH₄⁺,
 O⁻N⁺H(BU-n)₃, ON=CMe₂, ON=CHPh, ON=CMePh, ピラゾール-1-イル, 1, 2,
 4-トリアゾール-1-イル, 1, 3, 4-トリアゾール-1-イル, 1, 2,
 3, 4-テトラゾール-1-イル, 1, 2, 3, 5-テトラゾール-1-イル,
 20 OCH₂OCOPh, OCH₂OCOCH₂Ph, OCH₂OCOCHMePh, OCH₂OCOCMe₂Ph, OCH₂OCO(2-Naph)
-

本発明化合物の除草剤としての施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、対
 象雑草、栽培作物等により差異はあるが、一般には有効成分量としてヘクタール
 25 (ha)当たり0.001～50kg程度、好ましくは0.01～10kg程度が適当
 である。

本発明化合物は必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、
 殺菌剤、植物生長調節剤および共力剤等と混合施用しても良い。

特に、他の除草剤と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト

化、混合薬剤の相乗作用による殺草スペクトラムの拡大や、より高い殺草効果が期待できる。この際、同時に複数の公知除草剤との組み合わせも可能である。

- 本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、一般には適当な固体担体または液体担体と混合して、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤および分解防止剤等を添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤および粒剤等任意の剤型にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。固体担体としては、例えばカオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸、合成珪酸塩があげられる。液体担体としては、例えば水、アルコール類（エチレングリコール、プロピレングリコール、イソプロパノール等）、芳香族炭化水素類（キシレン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン等）、エーテル類（ブチルセロソルブ等）、ケトン類（シクロヘキサノン等）、エステル類（ γ -ブチロラクトン等）、酸アミド類（N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン等）および植物油（大豆油、ナタネ油、綿実油、ヒマシ油等）があげられる。これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン性界面活性剤、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸および燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸および燐酸塩およびアルキルアミン塩等のイオン性界面活性剤があげられる。これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の粒

剤 100 重量部に対し、通常 0.05 ~ 20 重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても 2 種以上を併用してもよい。

次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において

5 「部」は重量部を意味する。

(水和剤)

	本発明化合物	0.1 ~ 80 部
	固体担体	5 ~ 98.9 部
	界面活性剤	1 ~ 10 部
10	その他	0 ~ 5 部

その他として、例えば固結防止剤などがあげられる。

(乳 剤)

	本発明化合物	0.1 ~ 30 部
	液体担体	5.5 ~ 95 部
15	界面活性剤	4.9 ~ 15 部

(フロアブル剤)

	本発明化合物	0.1 ~ 70 部
	液体担体	1.5 ~ 98.89 部
	界面活性剤	1 ~ 12 部
20	その他	0.01 ~ 30 部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等があげられる。

(ドライフロアブル剤)

	本発明化合物	0.1 ~ 90 部
	固体担体	0 ~ 98.9 部
25	界面活性剤	1 ~ 20 部
	その他	0 ~ 10 部

その他として、例えば結合剤等があげられる。

(液 剤)

	本発明化合物	0.01 ~ 30 部
--	--------	-------------

110

液体担体	0.1~50部
水	50~98.89部
その他	0~10部

その他として、例えば凍結防止剤等があげられる。

5 (粒 剤)

本発明化合物	0.01~10部
固体担体	90~99.99部
その他	0~10部

その他として、例えば結合剤等があげられる。

10 (配合例1) 水和剤

本発明化合物 No. 1 a - 9	20部
バイロフィライト	76部
ソルポール 5039	2部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業

15 (株) 商品名)

カープレックス# 80	2部
-------------	----

(合成含水珪酸：塩野義製薬(株) 商品名)

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

(配合例2) 乳 剤

20 本発明化合物 No. 1 a - 9	5部
キシレン	75部
N-メチルピロリドン	15部
ソルポール 2680	5部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業

25 (株) 商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

(配合例3) フロアブル剤

本発明化合物 No. 1 a - 9	25部
アグリゾール S-710	10部

(非イオン性界面活性剤：花王（株）商品名)

ルノックス 1000C ————— 0.5 部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名)

キサンタンガム ————— 0.02 部

5 水 ————— 64.48 部

以上を均一に混合した後、湿式粉碎してフロアブル剤とする。

(配合例 4) ドライフロアブル剤

本発明化合物 No. 1 a - 9 ————— 75 部

ハイテノール NE-15 ————— 5 部

10 (アニオン性界面活性剤：第一工業製薬（株）商品名)

バニレックス N ————— 10 部

(アニオン性界面活性剤：日本製紙（株）商品名)

カープレックス # 80 ————— 10 部

(合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名)

15 以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥してドライフロアブル剤とする。

(配合例 5) 粒 剤

本発明化合物 No. 1 a - 9 ————— 1 部

ベントナイト ————— 55 部

20 タルク ————— 44 部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

使用に際しては上記製剤をそのまま、または、水で 1 ~ 10000 倍に希釈して、有効成分が 1 ヘクタール (ha) 当たり 0.001 ~ 50 kg、好ましくは 0.

25 0.1 ~ 10 kg になるように散布する。

本発明化合物は、畑地用の除草剤として、土壌処理、土壌混和処理、茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。本発明化合物の対象とする畑地雑草 (Cropland weeds) としては、例えば、イヌホウズキ (Solanum nigrum)、チョウセンアサガオ (Datura stramonium) 等に代表されるナス科 (Solanaceae) 雑

- 草、イチビ (Abutilon theophrasti)、アメリカキンゴジカ (Side spinosa) 等に代表されるアオイ科 (Malvaceae) 雑草、マルバアサガオ (Ipomoea purpurea) 等のアサガオ類 (Ipomoea spp.) やヒルガオ類 (Calystegia spp.) 等に代表されるヒルガオ科 (Convolvulaceae) 雑草、イヌビユ
- 5 (Amaranthus lividus)、アオビユ (Amaranthus viridis) 等に代表されるヒユ科 (Amaranthaceae) 雑草、オナモミ (Xanthium strumarium)、ブタクサ (Ambrosia artemisiaefolia)、ヒマワリ (Helianthus annuus)、ハキダメギク (Galinsoga ciliat)、セイヨウトゲアザミ (Cirsium arvense)、ノボロギク (Senecio vulgaris)、ヒメジョオン (Erigeron annuus) 等に代表されるキク科
- 10 (Compositae) 雑草、イヌガラシ (Rorippa indica)、ノハラガラシ (Sinapis arvensis)、ナズナ (Capsella Bursapastris) 等に代表されるアブラナ科 (Cruciferae) 雑草、イヌタデ (Polygonum Blumei)、ソバカズラ (Polygonum convolvulus) 等に代表されるタデ科 (Polygonaceae) 雑草、スベリヒユ (Portulaca oleracea) 等に代表されるスベリヒユ科 (Portulacaceae) 雑草、
- 15 シロザ (Chenopodium album)、コアカザ (Chenopodium ficifolium)、ホウキギ (Kochia scoparia) 等に代表されるアカザ科 (Chenopodiaceae) 雑草、ハコベ (Stellaria media) 等に代表されるナデシコ科 (Caryophyllaceae) 雑草、オオイヌノフグリ (Veronica persica) 等に代表されるゴマノハグサ科 (Scrophulariaceae) 雑草、ツユクサ (Commelina communis) 等に代表されるツ
- 20 ユクサ科 (Commelinaceae) 雑草、ホトケノザ (Lamium amplexicaule)、ヒメオドリコソウ (Lamium purpureum) 等に代表されるシソ科 (Labiatae) 雑草、コニシキソウ (Euphorbia supina)、オオニシキソウ (Euphorbia maculata) 等に代表されるトウダイグサ科 (Euphorbiaceae) 雑草、トゲナシヤエムグラ (Galium spurium)、ヤエムグラ (Galium aparine)、アカネ (Rubia akane) 等に代表され
- 25 るアカネ科 (Rubiaceae) 雑草、スミレ (Viola arvensis) 等に代表されるスミレ科 (Violaceae) 雑草、アメリカツノクサネム (Sesbania exaltata)、エビスグサ (Cassia obtusifolia) 等に代表されるマメ科 (Leguminosae) 雑草等の広葉雑草 (Broad-leaved weeds)、野生ソルガム (Sorghum bicolor)、オオクサキビ (Panicum dichotomiflorum)、ジョンソングラス (Sorghum halepense)、イヌ

5 ビエ (Echinochloa crus-galli)、メヒシバ (Digitaria adscendens)、'カラスムギ (Avena fatua)、オヒシバ (Eleusine indica)、エノコログサ (Setaria viridis)、スズメノテッポウ (Alopecurus aequalis) 等に代表されるイネ科雑草 (Graminaceous weeds)、ハマスゲ (Cyperus rotundus, Cyperus esculentus) 等に代表されるカヤツリグサ科雑草 (Cyperaceous weeds) 等があげられる。

また、本発明化合物は畑地、水田、果樹園などの農園芸分野以外に運動場、空地、線路端など非農耕地における各種雑草の防除にも適用することができる。

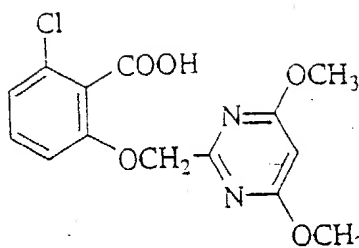
10 次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

(試験例 1) 土壌処理によるダイズ適用性試験

15 縦 30cm、横 30cm、深さ 5cm のプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ブタクサ(A)、アオビユ(B)、シロザ(C)、アメリカアサガオ(D)、アメリカツノクサネム(E)、チョウセンアサガオ(F)、イチビ(G)、オナモミ(H)、キハマスゲ(I)、アキノエノコログサ(J)、メヒシバ(K)、シャターケーン(L)およびダイズ(a)の種子をそれぞれスポット状に播種し、約 1.5cm 覆土した後、本発明化合物および比較化合物の有効成分量が所定の割合になるように土壌表面へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例 1 に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用いた。薬液散布 3 週間後に各種雑草に対する除草効果および作物に及ぼす影響について、下記の判定基準に従い調査した。抑制の程度は肉眼による観察調査から求めた。結果を第 7 表に示す。

- 20 5: 完全枯死あるいは 90%以上の抑制
4: 70%~90%の抑制
3: 40%~70%の抑制
25 2: 20%~40%の抑制
1: 5%~20%の抑制
0: 5%未満の抑制

なお、比較化合物は、下に示した特開平 4-327578 号公報記載の No. 22 の化合物である。



(試験例 2) 茎葉処理によるコムギおよびオオムギ適用性試験

- 縦 21cm、横 13cm、深さ 7cm のプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、
 ヤエムグラ(A)、オオイヌノフグリ(B)、シロザ(C)、イヌタデ(D)、コシカギク
 5 (E)、ブラックグラス(F)、カラスムギ(G)、イタリアンライグラス(H)、コムギ
 (a)およびオオムギ(b)の種子をそれぞれスポット状に播種し、約 1.5cm 覆土した。
 各植物が 1~2 葉期に達したとき、本発明化合物および比較化合物の有効成分量
 が所定の割合になるように茎葉部へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の
 薬液は、前記配合例 1 に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用いた。薬
 10 液散布 3 週間後に各種雑草に対する除草効果および作物に及ぼす影響について、
 試験例 1 の判定基準に従い調査した。結果を第 8 表に示す。なお、比較化合物は
 試験例 1 の場合と同一である。

(試験例 3) 土壌処理によるコムギ適用性試験

- 縦 21cm、横 13cm、深さ 7cm のプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、
 15 オオイヌノフグリ(A)、ハコベ(B)およびコムギ(a)の種子を混播し、約 1cm 覆土
 した。本発明化合物の有効成分量が所定の割合になるように土壌表面へ小型スプ
 レーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例 1 に準じて適宜調整され
 た水和剤を水で希釈して用いた。薬液散布後 4 週間後に各種雑草に対する除草効
 果および作物に及ぼす影響について、試験例 1 の判定基準に従い調査した。結果
 20 を第 9 表に示す。なお、表中の化合物 No. は実施例に記載した化合物番号に対応
 する。

(試験例 4) 茎葉処理によるコムギ適用性試験

- 縦 21cm、横 13cm、深さ 7cm のプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、
 オオイヌノフグリ(A)、ハコベ(B)およびコムギ(a)の種子を混播し、約 1cm 覆土

した後、25～30℃の室温に置いて植物を14日間育成した。その後、本発明化合物の有効成分量が所定の割合になるように茎葉部へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例1に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用いた。薬液散布後4週間後に各種雑草に対する除草効果および作物に及ぼす影響について、試験例1の判定基準に従い調査した。結果を第9表に示す。なお、表中の化合物No.は実施例に記載した化合物番号に対応する。

第7表

10 -	化合物	処理薬量													
	No.	g/a	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L	a
	本発明化合物	0.4	5	0	3	4	5	4	2	5	5	2	3	5	0
	1a-9	1.6	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0
15	比較化合物	0.4	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1	0
		1.6	0	0	0	0	0	0	4	3	0	0	0	4	2

第8表

20	化合物	処理薬量										
	No.	g/a	A	B	C	D	E	F	G	H	a	b
	本発明化合物	0.1	5	5	5	5	5	5	5	3	0	0
	1a-13	0.4	5	5	5	5	5	5	5	4	2	2
25	比較化合物	0.1	2	3	1	3	0	0	0	0	0	0
		0.4	3	4	2	4	4	0	0	0	0	0

第9表

		試験例 3			試験例 4			
5	化合物 No.	処理薬量 g/a	A	B	a	A	B	a
10	1a-1	50	0	0	0	0	2	0
	1a-2	6.3	5	5	0	5	5	0
	1a-4	6.3	0	0	0	1	0	0
	1a-5	6.3	0	0	0	0	5	0
	1a-6	6.3	3	5	0	5	5	0
	1a-7	50	5	5	0	5	5	1
	1a-8	6.3	0	0	0	0	4	0
	15	1a-9	6.3	5	5	4	5	5
20	1a-10	6.3	5	5	4	5	5	1
	1a-11	6.3	2	5	0	2	5	0
	1a-12	6.3	5	1	0	5	5	0
	1a-13	6.3	5	5	5	5	5	5
	1a-14	6.3	0	1	0	2	5	0
	1a-15	10	0	0	0	0	5	0
	1a-16	6.3	5	5	3	5	5	4
	1a-17	25	0	5	0	3	5	0
25	1a-18	25	0	5	0	0	5	0
	1a-19	6.3	5	5	1	5	5	0
	1a-20	6.3	5	5	0	5	5	0

第9表 (続き)

		試験例 3			試験例 4			
5	化合物	処理薬量	A	B	a	A	B	a
	No.	g/a						
10	1a-21	6.3	2	4	0	4	5	0
	1a-22	6.3	3	4	0	4	5	0
	1a-23	6.3	3	3	0	5	5	0
	1a-24	25	4	5	2	5	5	2
	1a-25	25	5	5	2	5	5	2
15	1a-26	6.3	-	5	4	5	5	3
	1a-27	25	4	3	0	5	5	0
	1a-28	25	0	0	0	0	3	0
	1a-29	6.3	5	5	5	5	5	3
	1a-30	6.3	-	5	0	5	5	2
20	1a-31	6.3	4	5	0	5	5	0
	1a-32	6.3	5	5	5	5	5	3
	1a-33	6.3	5	5	2	5	5	3
	1a-34	25	0	4	1	5	5	1
	1a-35	25	0	0	0	0	5	0
25	1a-36	25	4	4	0	5	5	0
	1a-37	6.3	4	4	3	5	5	1
	1a-38	25	-	4	0	0	5	0
	1a-39	25	4	1	0	5	4	0
	1a-40	6.3	5	5	0	3	5	0

第9表 (続き)

		試験例 3			試験例 4		
5	化合物 No.	処理薬量 g/a	A	B	a	A	B a
10	1a-41	25	3	0	0	3	0 0
	1a-42	6.3	5	3	1	5	5 1
	1a-43	6.3	5	5	1	5	5 1
	1a-44	25	0	0	0	2	5 0
	1a-45	6.3	0	0	0	5	3 0
	1a-46	25	0	0	0	4	1 0
15	1a-50	6.3	5	3	0	5	5 0
	1a-51	25	0	0	0	0	4 0
	1a-52	6.3	0	0	0	4	3 0
	1a-54	25	0	0	0	4	5 0
	1a-55	25	5	5	0	5	5 0
	1a-56	6.3	4	5	-	5	5 1
20	1a-57	25	0	0	0	4	5 0
	1a-58	25	0	0	0	4	0 0
	1a-59	6.3	0	0	0	4	5 0
	1a-60	6.3	0	0	0	5	5 0
	1a-61	6.3	0	0	0	0	4 0
	1a-63	25	0	2	0	-	5 0
25	1a-65	25	4	3	0	5	5 0
	1a-66	25	0	0	0	0	4 0

第9表 (続き)

		試験例 3			試験例 4			
5	化合物	处理薬量	A	B	a	A	B	a
	No.	g/a						
10	1a-67	25	0	0	0	0	4	0
	1a-68	6.3	3	3	0	5	5	0
	1a-69	25	0	0	0	0	3	0
	1a-70	25	3	5	0	4	5	0
	1a-71	25	4	4	0	-	5	0
	1a-72	25	5	5	5	5	5	4
	1a-73	25	5	5	0	5	5	0
15	1a-74	25	0	0	0	4	4	0
	1a-75	25	0	0	0	1	4	0
	1a-76	25	1	1	0	5	5	2
	1a-77	25	0	3	0	5	4	0
	1a-78	25	5	5	0	5	5	4
20	1a-79	25	4	5	0	4	5	0
	1a-80	6.3	3	3	1	3	5	0
	1a-81	6.3	0	4	0	4	5	0
	1a-82	25	5	5	0	5	5	1
25	1a-83	6.3	0	0	0	0	4	0
	1a-84	25	5	5	2	5	5	4
	1a-85	6.3	2	5	0	3	5	0
	1a-86	6.3	4	5	1	3	5	0

第9表 (続き)

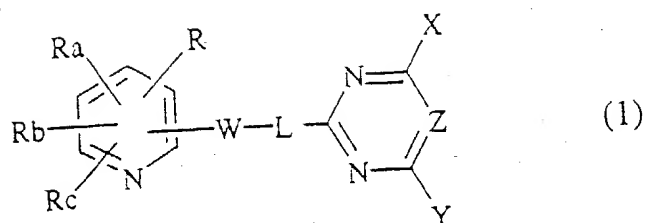
5	化合物 No.	処理薬量 g/a	試験例 3			試験例 4		
			A	B	a	A	B	a
10	1a-87	25	5	5	0	5	5	0
	1a-88	6.3	0	3	0	1	5	0
	1a-89	25	5	5	0	5	5	1
	1a-91	6.3	4	4	0	0	5	0
	1a-92	50	0	1	0	0	5	0
	1a-93	25	5	5	0	5	5	0
	1a-94	25	5	5	0	5	5	0
	1c-1	6.3	0	0	0	0	5	0
	1c-2	6.3	0	0	0	0	5	0

産業上の利用可能性

- 20 本発明のピリジン化合物は、農薬、特に除草剤として有用なものであり、この化合物を有効成分として含有する除草剤は、ナス科雑草、アオイ科雑草、ヒルガオ科雑草、ヒユ科雑草、キク科雑草、アブラナ科雑草、タデ科雑草、アカザ科雑草、ナデシコ科雑草、ゴマノハグサ科雑草、ツユクサ科雑草、シソ科雑草、トウダイグサ科雑草、アカネ科雑草、スミレ科雑草、マメ科雑草などの広葉雑草、イ
- 25 ネ科雑草及びカヤツリグサ科雑草等に有効である。

請求の範囲

1. 式(1):



式中、

- 5 RはCOR¹、シアノ基、ヒドロキシメチル基、アミノメチル基、ニトロメチル基またはハロメチル基を表し、

- R¹は水素原子、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、ベンジルオキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、シアノアミノ基、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁₋₄ハロアルキルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれた1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、ハロゲン原子によって置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルコキシ基によって置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基によって置換されたC₁₋₆アルコキシ
- 15 基、C₁₋₆アルキル基、イミダゾール-1-イル基、ピラゾール-1-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 3, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル基、1, 2, 3, 5-テトラゾール-1-イル基、ON=CR²R³、R⁴R⁵N、OCH₂OC(O)R⁶またはOMを表し、

- 20 R²およびR³は各々独立して水素原子、C₁₋₆アルキル基またはフェニル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)を表し、

- R⁴およびR⁵は各々独立して水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₃₋
- 25 キル基、

シクロアルキル基で置換された C_{1-2} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基（但し、 R^4 と R^5 が同時にアルコキシ基を表すことはない。）、フェニル基（ C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）またはベンジル基を表し、但し、 R^4 および R^5 は結合している窒素原子とともに3～9員環を構成してもよく、環内に酸素原子、硫黄原子、 C_{1-4} アルキル基で置換されていてもよい窒素原子、カルボニル基、スルホニル基または不飽和結合を含んでいてもよく、環は C_{1-4} アルキル基によって置換されていてもよく、環は C_{1-4} アルキレンによって架橋されていてもよく、環はベンゼン環によって縮合されていてもよく、

R^6 はフェニル基（ C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）、フェニル基（ C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。）によって置換された C_{1-3} アルキル基またはナフテル基を表し、

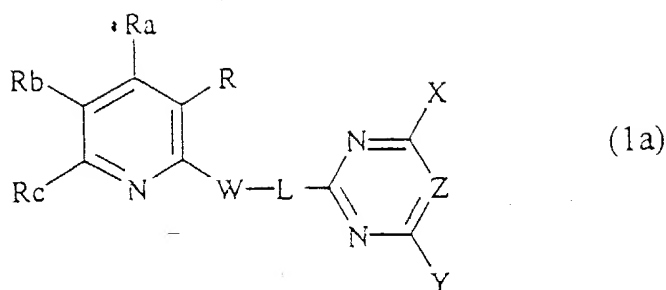
M はアルカリ金属原子、アルカリ土類金属原子または C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよいアンモニウムカチオンを表し、

R^a 、 R^b および R^c は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、メルカプト基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{3-6} シクロアルキル基、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-4} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、ホルミル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルボキシル基、 C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、水酸基により置換された C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{2-6} ハロアルケニル基、 C_{2-6} ハロアルキニル基、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ C_{2-4} アルケニル基、 C_{1-4} アルコキシ C_{2-4} アルキニル基、フェニル基（ C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シア

- ノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェノキシ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されて
- 5 いてもよい。)、フェニルチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェニルカルボニル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されて
- 10 いてもよい。)、フェニルスルホニル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、ベンジル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されてい
- 15 てもよい。)、ベンジルオキシ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリーロキシ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1
- 20 または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチルオキシ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリール基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、
- 25 シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘ

- テロアリアルチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリアルメチルチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、シクロプロピル基 (ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基 (ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、 R^4R^5N 、 $R^4ON=R^5C$ 、 $R^4R^5NN=R^5C$ 、 R^4R^5NC (W^1)、(R^5W^1) (R^4W^1) $R^{11}C$ 、アジド基またはアジドメチル基を表し、
- 5~6員ヘテロアリアルはチオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、ピロール-1-イル基、ピロール-2-イル基、ピロール-3-イル基、オキサゾール-2-イル基、オキサゾール-4-イル基、オキサゾール-5-イル基、チアゾール-2-イル基、チアゾール-4-イル基、チアゾール-5-イル基、イミダゾール-1-イル基、イミダゾール-2-イル基、イミダゾール-4-イル基、イミダゾール-5-イル基、イソオキサゾール-3-イル基、イソオキサゾール-4-イル基、イソオキサゾール-5-イル基、イソチアゾール-3-イル基、イソチアゾール-4-イル基、イソチアゾール-5-イル基、ピラゾール-1-イル基、ピラゾール-3-イル基、ピラゾール-4-イル基、ピラゾール-5-イル基、1,3,4-オキサジアゾール-2-イル基、1,3,4-チアジアゾール-2-イル基、1,3,4-トリアゾール-1-イル基、1,3,4-トリアゾール-2-イル基、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル基、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル基、1,2,4-チアジアゾール-3-イル基、1,2,4-チアジアゾール-5-イル基、1,2,4-トリアゾール-1-イル基、1,2,4-トリアゾール-3-イル基、1,2,4-トリアゾール-5-イル基、1,2,3-オキサジアゾール-4-イル基、1,2,3-オキサジアゾール-5-イル基、1,2,3-チアジアゾール-3-イル基、1,2,3-チアジアゾール-5-イル基、

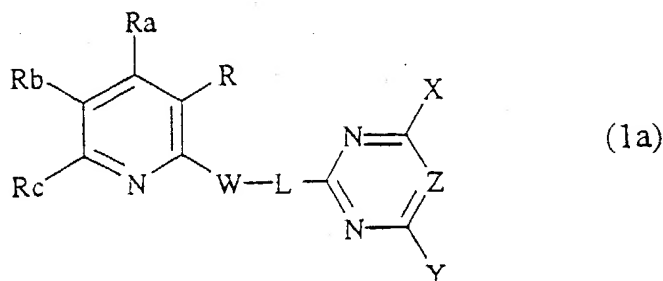
- 1, 2, 3-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-4-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-5-イル基、1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル基、1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル基、1, 2, 3, 5-テトラゾール-1-イル基、1, 2, 3, 5-テトラゾール-4-イル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、ピリミジン-2-イル基、ピリミジン-5-イル基、ピリミジン-4-イル基、ピラジン-2-イル基、ピリダジン-3-イル基、ピリダジン-4-イル基、1, 3, 5-トリアジン-2-イル基、1, 2, 4-トリアジン-3-イル基、1, 2, 4-トリアジン-5-イル基または1, 2, 4-トリアジン-6-イル基を表し、
- 10 R^7 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{3-6} シクロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基または C_{1-4} ハロアルキル基を表し、
 R^8 は水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、
 R^9 および R^{10} は各々独立して C_{1-6} アルキル基を表し、但し、 R^9 および R^{10} は結合している酸素原子または硫黄原子とともに5または6員環を構成してもよく、
- 15 R^{11} は水素原子または C_{1-6} アルキル基を表し、
 X および Y は各々独立して水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} ハロアルコキシ基またはハロゲン原子を表し、
 Z はCHまたは窒素原子を表し、
- 20 W は酸素原子、硫黄原子または $R^{12}N$ を表し、
 R^{12} は水素原子、ホルミル基または C_{1-4} アルキル基を表し、
 W' は酸素原子または硫黄原子を表し、
 L は C_{1-3} アルキレン鎖を表し、
 n は0、1、2または3を表す。
- 25 但し、



- を表す場合、R b および R c は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、メルカプト基、C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₄アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、
- 5 C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、ホルミル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルボキシ基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、水酸基により置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₄アルコキシC₁₋₄アル
- 10 キル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルケニル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルキニル基、フェニル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリール基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、
- 15 シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールメチル基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールメチルチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲ
- 20 アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲ

ン原子から選ばれる 1 または 2 以上の置換基によって置換されていてもよい。)、
 シクロプロピル基 (ハロゲン原子および C₁₋₄ アルキル基から選ばれる 1 または
 2 以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基 (ハロゲン原子お
 よび C₁₋₄ アルキル基から選ばれる 1 または 2 以上の置換基によって置換されて
 5 いてもよい)、R⁴R⁵N、R⁷ON=R⁸C、R⁴R⁵NN=R⁸C、R⁴R⁵NC
 (W¹)、(R⁹W¹) (R¹⁰W¹) R¹¹C、アジド基またはアジドメチル基を表す、
 で表されるピリジン化合物を有効成分として含有する除草剤。

2. 式 (1a):



式中、R_a、R_bおよびR_cは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、
 10 ニトロ基、水酸基、メルカプト基、C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆
 アルキニル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₄アルキル
 基、C₁₋₆アルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、
 C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニ
 ル基、ホルミル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル
 15 基、カルボキシ基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、水酸基により置換さ
 れたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆
 ハロアルキニル基、C₁₋₄アルコキシC₁₋₄アルキル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄
 アルケニル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルキニル基、フェニル基 (C₁₋₄アルキ
 ル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄
 20 アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる 1 または 2 以上の置換基
 によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリール基 (C₁₋₄アルキル
 基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄ア
 ルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる 1 または 2 以上の置換基に
 よって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチル基 (C₁₋₄アル

キル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置

換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールチオ基(C₁、
アルキル基、C₁、ハロアルキル基、C₁、アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、

5 C₁₋₄-アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5~6員ヘテロアリールメチルチオ基(C₁₋₄-アルキル基、C₁₋₄-ハロアルキル基、C₁₋₄-アルコキシ基、シアノ基、ニ

トロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、シクロプロピル基（ハロゲン

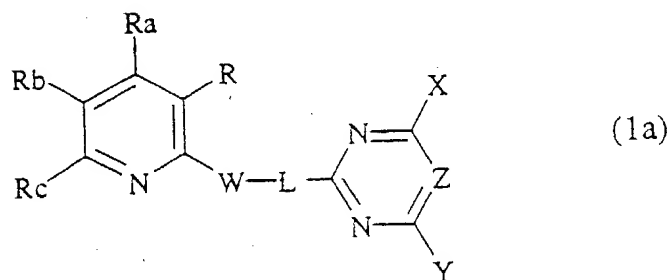
10 原子およびC₁₋₄-アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基(ハロゲン原子およびC₁₋₄-アルキル基から選

ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、 R^4R^5N 、 $R^4ON=R^8C$ 、 $R^4R^5NN=R^8C$ 、 $R^4R^5NC(W^1)$ 、 (R^9W^1) ($R^{10}W^1$)

$R^{11}C$ 、アジド基またはアジドメチル基を表す、

15 で表される請求の範囲第1項記載のピリジン化合物。

3. 式 (1 a):



式中、R_aはフェノキシ基（C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以

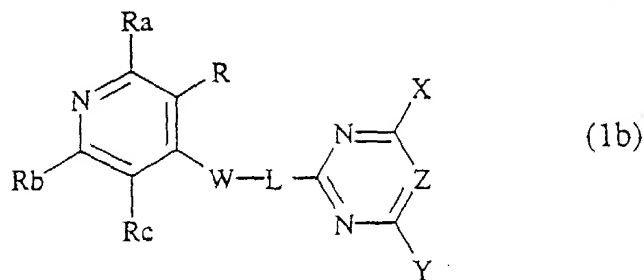
上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェニルチオ基 (C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハ

ロゲン原子から選ばれる 1 または 2 以上の置換基によって置換されていてもよい。)、フェニルカルボニル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4}

アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、フェニルスルホニル基 ($\text{C}_6\text{H}_5\text{SO}_2$)、

- アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基
 およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されてい
 てもよい。)、ベンジル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アル
 コキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上
 5 の置換基によって置換されていてもよい。)、ベンジロキシ基 (C_{1-4} アルキル
 基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基およびハ
 ロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよ
 い。)、5~6員ヘテロアリーロキシ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキ
 ル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基
 10 およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されてい
 てもよい。)、または5~6員ヘテロアリールメチロキシ基 (C_{1-4} アルキル基、
 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキ
 ルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によ
 って置換されていてもよい。)を表す、
- 15 で表される請求の範囲第1項記載のピリジン化合物。

4. 式 (1b):

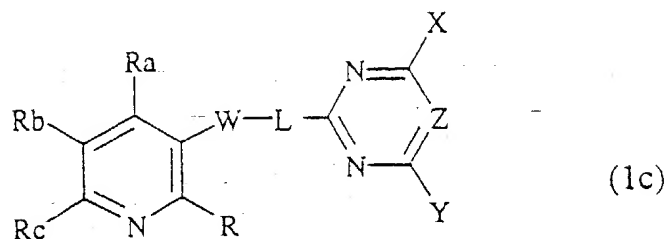


- 式中、 R_a 、 R_b および R_c は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、
 ニトロ基、水酸基、メルカプト基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6}
 C_{1-6} アルキニル基、 C_{3-6} シクロアルキル基、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-4} アルキル
 20 基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、
 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニ
 ル基、ホルミル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル
 基、ベンジロキシカルボニル基、カルボキシ基、 C_{1-6} アルキルカルボニル
 オキシ基、水酸基により置換された C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、

- C_{2-6} ハロアルケニル基、 C_{2-6} ハロアルキニル基、 C_{1-4} アルゴキシ C_{1-4} アル
 キル基、 C_{1-4} アルコキシ C_{2-4} アルケニル基、 C_{1-4} アルコキシ C_{2-4} アルキニ
 ル基、フェニル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ
 基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から
 5 選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘ
 テロアリールオキシ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコ
 キシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子
 から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6
 員ヘテロアリール基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキ
 10 シ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子か
 ら選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員
 ヘテロアリールメチル基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アル
 コキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原
 子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~
 15 6員ヘテロアリールチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} ア
 ルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン
 原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5
 ~6員ヘテロアリールメチルチオ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、
 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基および
 20 ハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよ
 い)、5~6員ヘテロアリールメチルオキシ基 (C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロ
 アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホ
 ニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換さ
 れていてもよい)、シクロプロピル基 (ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基か
 25 ら選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ
 基 (ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基
 によって置換されていてもよい)、 R^4R^5N 、 $R^7ON=R^8C$ 、 $R^4R^5NN=R^8C$ 、 R^4R^5NC (W^1)、 (R^9W^1) ($R^{10}W^1$) $R^{11}C$ 、アジド基またはアジド
 メチル基を表す、

で表される請求の範囲第1項記載のピリジン化合物。

5. 式(1c):



- 式中、R_a、R_bおよびR_cは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、メルカプト基、C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₄アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、ホルミル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルボキシ基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、水酸基により置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₄アルコキシC₁₋₄アルキル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルケニル基、C₁₋₄アルコキシC₂₋₄アルキニル基、フェニル基(C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールオキシ基(C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリール基(C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールメチル基(C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、5~6員ヘテロアリールチオ基(C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)。

- ・ ルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5～6員ヘテロアリールメチルチオ基(C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、5～6員ヘテロアリールメチルオキシ基(C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基およびハロゲン原子から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい。)、シクロプロピル基(ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、エポキシ基(ハロゲン原子および C_{1-4} アルキル基から選ばれる1または2以上の置換基によって置換されていてもよい)、 R^4R^5N 、 $R^7ON=R^8C$ 、 $R^4R^5NN=R^8C$ 、 $R^4R^5NC(W^1)$ 、 (R^9W^1) 、 $(R^{10}W^1)$ 、 $R^{11}C$ 、アジド基またはアジドメチル基を表す、
- 15 で表される請求の範囲第1項記載のピリジン化合物。
6. 請求の範囲第2項ないし第5項のピリジン化合物を有効成分として含有する農薬。
7. 請求の範囲第2項ないし第5項のピリジン化合物を有効成分として含有する除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/02684

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁵ C07D401/12, 14, A01N43/54, 66

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁵ C07D401/12, 14, A01N43/54, 66

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA, REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, 64-84, A (Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.), January 5, 1989 (05. 01. 89), Claims & EP, 249707, A & AU, 8771418, A & BR, 8701751, A & US, 4832729, A & US, 4931087, A	1-7
A	JP, 2-108674, A (Schering AG.), April 20, 1990 (20. 04. 90), Claims & AU, 8939549, A & CN, 1040588, A	1-7
A	JP, 4-1192, A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), January 6, 1992 (06. 01. 92), Claims (Family: none)	1-7
A	JP, 2-121973, A (BASF AG.), May 9, 1990 (09. 05. 90), Claims & EP, 360163, A & DE, 3832237, A & US, 5015285, A	1-7

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.
 ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"U" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
August 13, 1998 (13. 08. 98)Date of mailing of the international search report
August 25, 1998 (25. 08. 98)Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/02684

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, 3-106876, A (BASF AG.), May 7, 1991 (07. 05. 91), Claims & DE, 3972382, A & EP, 414058, A & CA, 2022747, A & US, 5085685, A	1-7
A	JP, 4-29980, A (Hokko Chemical Industry Co., Ltd.), January 31, 1992 (31. 01. 92), Claims (Family: none)	1-7
A	JP, 4-221372, A (Mitsui Toatsu Chemicals, Inc.), August 11, 1992 (11. 08. 92), Claims (Family: none)	1-7
A	JP, 4-305577, A (Bayer AG.), October 28, 1992 (28. 10. 92), Claims & DE, 4025338, A & EP, 472925, A & CA, 2048542, A & BR, 9103423, A & ZA, 9106296, A & US, 5215569, A	1-7
A	JP, 4-321670, A (CIBA-Geigy AG.), November 11, 1992 (11. 11. 92), Claims & GB, 2250985, A & EP, 493321, A1 & AU, 9189983, A & CA, 2058099, A & BR, 9105375, A & ZA, 9110045, A & US, 5262386, A	1-7
A	JP, 5-247005, A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), August 24, 1993 (24. 08. 93), Claims & EP, 549344, A & AU, 9230100, A & CA, 2085387, A	1-7
A	JP, 5-331363, A (Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.), December 14, 1993 (14. 12. 93), Claims & WO, 92/17468, A1 & AU, 9214517, A & EP, 532761, A1 & BR, 9204796, A & US, 5380700, A & US, 5385880, A & CN, 1080637, A	1-7

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))
Int.Cl⁶ C07D401/12, 14, A01N43/54, 66

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))
Int.Cl⁶ C07D401/12, 14, A01N43/54, 66

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
CA, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP, 64-84, A (クミアイ化学工業株式会社), 5. 1月. 1989 (05. 01. 89), 請求の範囲 & EP, 249707, A&AU, 8771418, A& BR, 8701751, A&US, 4832729, A& US, 4931087, A&	1-7
A	JP, 2-108674, A (シエーリング・アクチエンゲゼルシャフト), 20. 4月. 1990 (20. 04. 90), 請求の範囲 & AU, 8939549, A&CN, 1040588, A	1-7
A	JP, 4-1192, A (日産化学工業株式会社), 6. 1月. 1992 (06. 01. 92), 請求の範囲 (ファミリーなし)	1-7

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの

「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日
13. 08. 98

国際調査報告の発送日

25.08.98

国際調査機関の名称及びあて先
日本国特許庁 (ISA/JP)
郵便番号 100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)
富永 保 印

4C 9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3454

C (続き) 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	J P, 2-121973, A (ビーエーエスエフ アクチエンゲゼルシャフト), 9. 5月. 1990 (09. 05. 90), 請求の範囲&EP, 360163, A&DE, 3832237, A&US, 5015285, A	1-7
A	J P, 3-106876, A (ビーエーエスエフ アクチエンゲゼルシャフト), 7. 5月. 1991 (07. 05. 91), 請求の範囲&DE, 3972382, A&EP, 414058, A&CA, 2022747, A&US, 5085685, A&	1-7
A	J P, 4-29980, A (北興化学工業株式会社), 31. 1月. 1992 (31. 01. 92), 請求の範囲 (ファミリーなし)	1-7
A	J P, 4-221372, A (三井東圧化学株式会社), 11. 8月. 1992 (11. 08. 92), 請求の範囲 (ファミリーなし)	1-7
A	J P, 4-305577, A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト), 28. 10月. 1992 (28. 10. 92), 請求の範囲&DE, 4025338, A&EP, 472925, A&CA, 2048542, A&BR, 9103423, A&ZA, 9106296, A&US, 5215569, A	1-7
A	J P, 4-321670, A (チバーガイギー アクチエンゲゼルシャフト), 11. 11月. 1992 (11. 11. 92), 請求の範囲&GB, 2250985, A&EP, 493321, A1&AU, 9189983, A&CA, 2058099, A&BR, 9105375, A&ZA, 9110045, A&US, 5262386, A	1-7
A	J P, 5-247005, A (住友化学工業株式会社), 24. 8月. 1993 (24. 08. 93), 請求の範囲&EP, 549344, A&AU, 9230100, A&CA, 2085387, A&	1-7
A	J P, 5-331363, A (クミアイ化学工業株式会社), 14. 12月. 1993 (14. 12. 93), 請求の範囲&WO, 92/17468, A1&AU, 9214517, A&EP, 532761, A1&BR, 9204796, A&US, 5380700, A&US, 5385880, A&CN, 1080637, A	1-7